

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平11-171702

(43) 公開日 平成11年(1999) 6月29日

(51) Int.Cl. ⁴ A 0 1 N 25/00 A 0 1 G 7/06 A 0 1 M 17/00 A 0 1 N 43/56 43/653	識別記号 1 0 2	F I A 0 1 N 25/00 A 0 1 G 7/06 A 0 1 M 17/00 A 0 1 N 43/56 43/653	1 0 2 A B D G
		審査請求	未請求 請求項の数26 O L (全 117 頁) 最終頁に続く
(21) 出願番号	特願平10-264372	(71) 出願人	000002934
(22) 出願日	平成10年(1998) 9月18日		武田薬品工業株式会社 大阪府大阪市中央区道修町四丁目1番1号
(31) 優先権主張番号	特願平9-258947	(72) 発明者	赤山 敦夫
(32) 優先日	平9(1997) 9月24日		茨城県つくば市東2丁目3番地6 リッシ エル筑波202号
(33) 優先権主張国	日本 (J P)	(74) 代理人	弁理士 朝日奈 忠夫 (外1名)

(54) 【発明の名称】 害虫防除方法

(57) 【要約】

【課題】本発明は、被子植物に対する害虫を省力的に防除するための殺虫方法を提供する。

【解決手段】播種または仮植前に農薬活性成分を混和した育苗用培土を充填した育苗用容器で育苗することと特徴とする、イネ科植物を除く被子植物に対する害虫の防除方法であり、育苗期ばかりでなく、本国に移植後も殺虫効果を発現させ、一度だけの処理で長期間の高い防除効果を発現させることを特徴とする害虫防除方法であり、従来の方法と比較して薬剤処理回数を大幅に減らすことができる。しかも、農閑期の作業として、育苗用培土調製時の通常作業として肥料などの混和時に同時に処理できる。その結果、大幅な労力低減を可能にする。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 播種または仮植前に農薬活性成分を混和した育苗用培土を充填した育苗用容器で育苗することと特徴とする、イネを除く被子植物に対する害虫の防除方法。

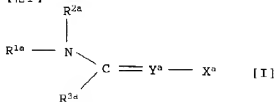
【請求項2】 被子植物が双子葉植物またはユリ目植物である請求項1記載の方法。

【請求項3】 被子植物がケシ目、アカザ目、バラ目、セリ目、ツバキ目、アオイ目、シソ目、ウリ目、キキョウ目、イソマツ目、モクセイ目、サクラソウ目またはユリ目植物である請求項1記載の方法。

【請求項4】 被子植物がアブラナ科、アカザ科、ナデシコ科、マメ科、バラ科、セリ科、スミレ科、アオイ科、ナス科、シソ科、ウリ科、キク科、イソマツ科、リンドウ科またはサクラソウ科である請求項1記載の方法。

【請求項5】 農薬活性成分が、式

【化1】



〔式中、 R^{1a} は水素原子、炭化水素基、アシル基または置換されていてもよい複素環基で置換されたアルキル基を、 R^{2a} は水素原子、炭化水素基または R^{3a} と結合する二価の基を、 R^{3a} は炭化水素基、 $-SR^{4a}$ (R^{4a} は R^{1a} と同意義を示す。)、 $-N(R^{5a})$ (R^{5a} および R^{6a} は同一または異なって、 R^{1a} と同意義を示す。)、または R^{2a} と結合する二価の基または原子を、 Y^a は $-N-$ または $-C(Z^{1a})-$ (Z^{1a} は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示す。)、 X^a は電子吸引基を示す。〕で表わされる化合物またはその塩である請求項1記載の方法。

【請求項6】 R^{1a} が(1)水素原子、(2) C_{1-6} アルキル基、(3) C_{8-10} シクロアルキル基、(4) C_{2-10} アルケニル基、(5) C_{2-10} アルキニル基、(6) C_{8-10} シクロアルケニル基、(7) C_{8-10} アリール基、(8) C_{7-10} アリール基、(9) C_{1-4} アルキル-カルボニル基、(10) C_{8-10} アリール-カルボニル基、(11) C_{1-4} アルキルスルホニル基または(12)(i) C_{1-6} アルキル基、(ii) C_{2-6} アルケニル基、(iii) C_{2-6} アルキニル基、(iv) C_{6-10} アリール基、(v) C_{7-9} アリール基、(vi)ニトロ基、(vii)水酸基、(viii)メルカプト基、(ix)オキソ基、(x)チオキソ基、(xi)シアノ基、(xii)カルバモイル基、(xiii)カルボキシル基、(xiv)ハロゲン基、(xv) C_{1-4} アルコキシ基、(xvi) C_{1-4} アルキルチオ基、(xvii) C_{1-4} アルキルスルフィニル基、(xviii) C_{6-10} アリールスルフィニル基、(xix) C_{1-4} アルキルスルホニル基、(xx) C_{8-10} アリールスルホニル基、(xxi)アミノ基、(xxii) C_{1-6} アシルアミノ基、

2

(xxiii)モノ又はジ- C_{1-4} アルキルアミノ基、(xxiv) C_{1-20} アシル基および(xv) $3 \sim 6$ 員複素環基またはそのベンゼン環もしくは $3 \sim 6$ 員複素環との縮合環基から選ばれる $1 \sim 5$ 個の置換基で置換されていてもよい $3 \sim 6$ 員複素環基またはそのベンゼン環もしくは $3 \sim 6$ 員複素環との縮合環基で置換されていてもよい C_{1-9} アルキル基である請求項5記載の方法。

【請求項7】 R^{2a} が水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{8-10} シクロアルキル基、 C_{2-10} アルケニル基、 C_{2-10} アルキニル基、 C_{8-10} シクロアルケニル基、 C_{6-10} アリール基、 C_{7-10} アリール基または R^{3a} と結合する C_{1-4} アルキル基、 $-CH_2N(Z^{2a})-CH_2-$ (Z^{2a} は水素、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-4} アルキル-カルボニル基を示す。)で表わされる基または $-CH_2-O-CH_2-$ である請求項5記載の方法。

【請求項8】 R^{3a} が C_{1-6} アルキル基、 C_{8-10} シクロアルキル基、 C_{2-10} アルケニル基、 C_{2-10} アルキニル基、 C_{8-10} シクロアルケニル基、 C_{6-10} アリール基、 C_{7-10} アリール基、 $-SR^{4a}$ (R^{4a} は、(i)水素原子、(2) C_{1-6} アルキル基、(3) C_{8-10} シクロアルキル基、(4) C_{2-10} アルケニル基、(5) C_{2-10} アルキニル基、(6) C_{8-10} シクロアルケニル基、(7) C_{8-10} アリール基、(8) C_{7-10} アリール基、(9) C_{1-4} アルキル-カルボニル基、(10) C_{8-10} アリール-カルボニル基、(11) C_{1-4} アルキルスルホニル基または(12)(i) C_{1-6} アルキル基、(ii) C_{2-6} アルケニル基、(iii) C_{2-6} アルキニル基、(iv) C_{6-10} アリール基、(v) C_{7-9} アリール基、(vi)ニトロ基、(vii)水酸基、(viii)メルカプト基、(ix)オキソ基、(x)チオキソ基、(xi)シアノ基、(xii)カルバモイル基、(xiii)カルボキシル基、(xiv)ハロゲン基、(xv) C_{1-4} アルコキシ基、(xvi) C_{1-4} アルキルチオ基、(xvii) C_{1-4} アルキルスルフィニル基、(xviii) C_{6-10} アリールスルフィニル基、(xix) C_{1-4} アルキルスルホニル基、(xx) C_{8-10} アリールスルホニル基、(xxi)アミノ基、(xxii) C_{1-6} アシルアミノ基、(xxiii)モノ又はジ- C_{1-4} アルキルアミノ基、(xxiv) C_{1-20} アシル基および(xv) $3 \sim 6$ 員複素環基またはそのベンゼン環もしくは $3 \sim 6$ 員複素環との縮合環基から選ばれる $1 \sim 5$ 個の置換基で置換されていてもよい $3 \sim 6$ 員複素環基またはそのベンゼン環もしくは $3 \sim 6$ 員複素環との縮合環基で置換されていてもよい C_{1-9} アルキル基を示す。〕で表わされる基、 $-N(R^{5a})$ (R^{5a}) (R^{5a} および R^{6a} は同一または異なって、 R^{1a} と同意義を示す。))で表わされる基または R^{2a} と結合する $-S-$ 、 C_{1-4} アルキレンもしくは $-N(Z^{3a})-$ (Z^{3a} は水素、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-4} アルキル-カルボニル基を示す。))である請求項5記載の方法。

【請求項9】 Y^a が $-N-$ または $-C(Z^{1a})-$ (Z^{1a} は水素原子、(i) C_{1-6} アルキル基、(ii) C_{2-6} アルケニル基、(iii) C_{2-6} アルキニル基、(iv) C_{6-10} アリール基、(v) C_{7-9} アリール基、(vi)ニトロ基、(vii)水酸

3

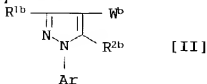
基、(viii)メルカプト基、(ix)オキソ基、(x)チオキソ基、(xi)シアノ基、(xii)カルバモイル基、(xiii)カルボキシル基、(xiv)ハロゲン、(xv) C₁₋₄アルコキシ基、(xvi) C₁₋₄アルキルチオ基、(xvii) C₁₋₄アルキルスルフィニル基、(xviii) C₆₋₁₀アリールスルフィニル基、(xix) C₁₋₄アルキルスルホニル基、(xx) C₆₋₁₀アリールスルホニル基、(xxi)アミノ基、(xxii) C₁₋₆アシルアミノ基、(xxiii)モノ-又はジ- C₁₋₄アルキルアミノ基、(xxiv) C₁₋₆アシル基および (xxv) 3〜6員複素環基またはそのベンゼン環もしくは3〜6員複素環との縮合環基から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよい C₁₋₆アルキル基、C₃₋₁₀シクロアルキル基、C₂₋₁₀アルケニル基、C₂₋₁₀アルキニル基、C₃₋₁₀シクロアルケニル基、C₆₋₁₀アリール基または C₇₋₁₀アラール基である請求項5記載の方法。

【請求項10】 X^aがシアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルコキシカルボニル基、ヒドロキシカルボニル基、C₆₋₁₀アリール-オキシカルボニル基、3〜6員複素環オキシカルボニル基、ハロゲンで置換されていてもよい C₁₋₄アルキルスルホニル基、スルファモイル基、ジ- C₁₋₄アルコキシホスホリル基、ハロゲンで置換されていてもよい C₁₋₄アシル基、C₆₋₁₀アリールカルボニル基、カルバモイル基または C₁₋₆アルキルスルホニルチオカルバモイルである請求項5記載の方法。

【請求項11】 R^{1a}が水素原子、C₁₋₆アルキル、ホルミル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₆₋₁₀アリールカルボニル、C₁₋₄アルキルスルホニルまたはハロゲンで置換されていてもよい5または6員複素環基で置換された C₁₋₉アルキルであり、R^{2a}が水素原子、C₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルキレンまたは R^{3a}と結合する -CH₂-N (Z^{2a}) -CH₂- (Z^{3a}) は水素原子、C₁₋₆アルキルまたは C₁₋₄アルキルカルボニルを示す。) もしくは -C(H₂-O-C(H₂-)であり、R^{3a}が C₁₋₆アルキル、-S-R^{41a} (R^{41a}は水素原子、C₁₋₆アルキルまたは C₁₋₄アルキルカルボニルを示す。)、-N (R^{51a}) (R^{51a}) (R^{51a}および R^{61a}は同一または異なって、水素または C₁₋₆アルキルを示す。)、または R^{2a}と結合する C₁₋₄アルキレン、-S-もしくは -N (Z^{3a}) - (Z^{3a}は Z^{2a}と同義を示す。) であり、Y^aが=N あるいは=CH-であり、X^aがニトロまたはシアノである請求項5記載の方法。

【請求項12】 農薬活性成分が式

【化2】



〔式中、Arは置換されていてもよい芳香族炭化水素基

4

または置換されていてもよい芳香族複素環基を、R^{1b}は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、カルボキシル、置換されていてもよい炭化水素基、硫黄原子を介する基または式

【化3】



(式中、X^{1b}は水素原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を、Y^{1b}は水素原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を示すか、あるいは X^{1b}と Y^{1b}とが合わさって、

【化4】



で表わされる基が置換されていてもよい含窒素複素環基を示す。) で表わされる基を、R^{2b}は水素原子、ハロゲン原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を、W^bはハロゲン原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を示す。) で表わされる化合物またはその塩である請求項1記載の方法。

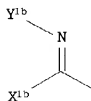
【請求項13】 Arが(1)ヒドロキシ、アミノ、モノ-もしくはジ- C₁₋₆アルキルアミノ、C₁₋₆アルコキシまたはハロゲン原子で置換されていてもよい C₁₋₆アルキル基、(2) C₁₋₆アルキルもしくは C₁₋₆アルカノイルでモノ-もしくはジ-置換されていてもよいアミノ基、(3)ヒドロキシ基、(4)カルボキシル基、(5)ニトロ基、(6) SF₆、(7) C₁₋₆アルコキシ基、(8) C₁₋₆アルカノイルオキシ基、(9)シアノ基および(10)ハロゲン原子から選ばれる1〜6個の置換基で置換されていてもよい C₆₋₁₄芳香族炭化水素基または5〜8員芳香族複素環基またはその C₆₋₁₀環状炭化水素または5〜6員複素環との縮合環基である請求項12記載の方法。

【請求項14】 Arがハロゲン、C₁₋₆アルキルおよびモノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化 C₁₋₆アルキルから選ばれる1〜5個の置換基で置換されたフェニル基である請求項12記載の方法。

【請求項15】 R^{1b}が(1)水素原子、(2)ハロゲン原子、(3)ニトロ基、(4)シアノ基、(5)カルボキシル基、(6) (i)ニトロ、(ii)ヒドロキシ、(iii)オキソ、(iv)チオキソ、(v)シアノ、(vi)カルバモイル、(vii)カルボキシ

ル、(viii) C₁₋₁₈ アシル基、(ix) スルホ基、(x) ハロゲン原子、(xi) モノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化されているてもよい(a) C₁₋₆ アルコキシおよび(b) C₆₋₁₄ アリールオキシから選ばれる C₁₋₁₄ 炭化水素オキシ基、(xii) -S(O)_{n^{2b}} R^{2b}〔式中、n^{2b}は0、1または2を、R^{2b}は C₁₋₆ アルキルおよび C₆₋₁₄ アリールから選ばれる C₁₋₁₄ 炭化水素基を示す。〕、(xiii) C₁₋₆ アルキルもしくは C₁₋₆ アルキル-カルボニルでモノ-もしくはジ-置換されているてもよいアミノ、(xiv) C₁₋₆ アルキルでモノ-もしくはジ-置換されているてもよいヒドラゾンおよび(xv) (a) ハロゲン原子、(b) C₁₋₆ アルキルおよび(c) モノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化フェノキシから選ばれる 1~4 個の置換基を有しているてもよい5または6員複素環基からなる群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基、(7) -S(O)_{n^{2b}} R^{2b}〔R^{2b}は上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基または(i) モノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基、(ii) C₁₋₁₄ 炭化水素オキシ基、(iii) C₁₋₁₈ アシル基、(iv) C₁₋₁₆ アシルオキシ基、(v) カルボキシル基、(vi) C₁₋₆ アルキルでモノ-もしくはジ-置換されているてもよいカルバモイル基、(vii) 環状アミノカルボニル基、(viii) ハロゲン原子、(ix) オキシ基、(x) アミノ基、(xi) C₁₋₆ アルキルで置換されているてもよいイミノ基、(xii) C₁₋₆ アルキル、カルバモイルもしくは N-モノ-もしくは N、N-ジ- C₁₋₄ アルキル-カルバモイルでモノ-もしくはジ-置換されているてもよいアミノ基、(xiii) 3~6 員環状アミノ基、(xiv) C₁₋₆ アルカノイルアミド基、(xv) ペンザミド、(xvi) C₁₋₉ アルケンジオキシ基、(xvii) -B(OH)₂、(xviii) ヒドロキシル基、(xix) ニトロ基、(xx) シアノ基、(xxi) -S(O)_{n^{2b}} R^{2b}〔式中、n^{2b}は0、1または2を、R^{2b}は水素原子または C₁₋₁₄ 炭化水素基を示す。〕および(xii) C₁₋₆ アルキルでモノ-もしくはジ-置換されているてもよいスルファモイル基からなる群(B)から選ばれる 1~6 個の置換基で置換されているてもよい3~8員複素環基またはその C₅₋₁₀ 環状炭化水素もしくは5~6員複素環と縮合環基を、n^{1b}は0~2の整数を示す。〕で表わされる基、または(8)式

【化5】

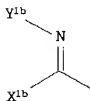


〔式中、X^{1b}は(i)水素原子、(ii)上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基、(iii)上記群(A)から選ばれる 1~5 個

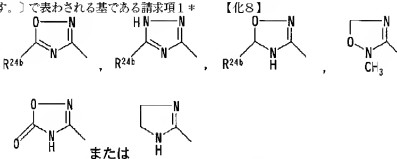
の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₄ アシル基、(iv) シアノ基、(v) 上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基で置換されているてもよいカルバモイル基、(vi) アミノ基、(vii) 上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい炭素原子に結合手を有する 3~8員複素環基またはその C₅₋₁₀ 環状炭化水素もしくは5~6員複素環と縮合環基、(viii) ニトロ基、(ix) -N(R^{2b})₂〔式中、R^{2b}および R^{2b}はそれぞれ(a)水素原子、(b)上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基、(c) 上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₄ アシル基、(d) 上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよいカルバモイル基、(e) 上記群(B)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい3~8員複素環基またはその C₅₋₁₀ 環状炭化水素もしくは5~6員複素環と縮合環基、(f) ヒドロキシル基、(g) 上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素オキシ基または(h) -S(O)_{n^{2b}} R^{2b}〔R^{2b}は水素原子または上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基を、n^{2b}は1~2の整数を示す。〕で表わされる基を示す。〕で表わされる基、(xi) 上記群(B)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい、窒素原子に結合手を有する 3~8員複素環基またはその C₅₋₁₀ 環状炭化水素もしくは5~6員複素環と縮合環基または(xii) -N=C(R^{2b})R^{2b}〔R^{2b}および R^{2b}はそれぞれ水素原子、上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基、上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素オキシ基または-N(R^{2b})₂〔R^{2b}および R^{2b}はそれぞれ水素原子、ヒドロキシル基または上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基を示す。〕で表わされる基、(xii) -OR^{12b}〔R^{12b}は(a)水素原子、(b)上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基、(c) 上記群(B)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい3~8員複素環基またはその C₅₋₁₀ 環状炭化水素もしくは5~6員複素環と縮合環基、(d) 上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₄ アシル基、(e) 上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基で置換されているてもよいカルバモイル基、(f) -N(R^{12b})R^{14b}〔式中、R^{12b}および R^{14b}はそれぞれ水素原子、上記群(A)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい C₁₋₂₀ 炭化水素基または上記群(B)から選ばれる 1~5 個の置換基で置換されているてもよい3~8員複素環基またはその C₅₋₁₀ 環状炭化水素もしくは

は5～6員複素環との縮合環基を示す。)で表わされる基または(g)-SiR^{16b}₃ (R^{16b}は上記群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基を示す。)で表わされる基を示す。)で表わされる基、(xiii)-S(O)_{n^{4b}}R^{16b} (R^{16b}は上記群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基または上記群(B)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよい3～8員複素環基またはそのC₆₋₁₀環状炭化水素もしくは5～6員複素環との縮合環基を、n^{4b}は0～2の整数を示す。)で表わされる基または(xiv)-P(O)(OR^{17b})₂ (R^{17b}は水素原子またはC₁₋₁₈アルキル基を示す。)で表わされる基を、Y^{1b}は上記X^{1b}と同意義を示すか、あるいはX^{1b}とY^{1b}とが合わさって、

【化6】



で表わされる基が、上記群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素またはオキシ基で1～3個置換されていてもよい含酸素5～8員複素環基を示す。)で表わされる基である請求項1*



(R^{24b}は水素原子またはC₁₋₆アルキル基を示す。)を形成する基を示す。)で表わされる基である請求項12記載の方法。

【請求項17】R^{2b}が(1)水素原子、(2)請求項15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(3)請求項15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₄アシル基、(4)シアノ基、(5)請求項15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₅炭化水素基で置換されていてもよいカルバモイル基、(6)アミノ基、(7)請求項15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよい炭素原子に結合手を有する3～8員複素環基またはそのC₆₋₁₀環状炭化水素もしくは5～6員複素環との縮合環基、(8)ニトロ基、(9)-NR^{6b}R^{6b} (式中、R^{6b}およびR^{6b}はそれぞれ(a)水素原子、(b)請求項50

*2記載の方法。

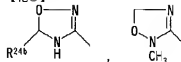
【請求項16】R^{1b}がシアノ基または式

【化7】



10 〔式中、X^{1b}は-NR^{20b}R^{21b} (R^{20b}およびR^{21b}はそれぞれ水素原子、ヒドロキシ、C₁₋₆アルカノイルまたはC₁₋₆アルキルを示す。)で表わされる基を、Y^{1b}は水素原子、ヒドロキシル基、C₁₋₆アルコキシでモノーもしくはジ-置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子でモノー、ジーもしくはトリ-置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイルオキシ基、モノーもしくはジ-置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシカルボニルオキシ基、C₁₋₆アルコキシカルボニルオキシ基、C₁₋₆アルキルで置換されていてもよいC₆₋₁₀アリールカルボニルオキシ基、式-NR^{22b}R^{23b} (式中、R^{22b}およびR^{23b}はそれぞれ水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルカノイル基またはC₁₋₆アルコキシカルボニル基を示す。)で表わされる基、C₁₋₆アルキル基、もしくはX^{1b}とY^{1b}とが合わさって

【化8】



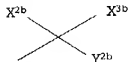
※15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(c)請求項15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₄アシル基、(d)請求項15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基で置換されていてもよいカルバモイル基、(e)請求項15記載の群(B)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよい3～8員複素環基またはそのC₆₋₁₀環状炭化水素もしくは5～6員複素環との縮合環基、(f)ヒドロキシル基、(g)請求項15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基オキシ基または(h)-S(O)_{n^{2b}}R^{6b} (R^{6b}は水素原子または請求項15記載の群(A)から選ばれた1～5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基を、n^{2b}は1～2の整数を示す。)で表わされる基を示す。)で表わされる

基、(10)請求項15記載の群(B)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよい、窒素原子に結合手を有する3～8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5～6員複素環との縮合環基または(11) $-N=C(R^{7b})R^{2b}$ (R^{7b} および R^{2b} はそれぞれ水素原子、請求項15記載の群(A)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、請求項15記載の群(A)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基または(12) $-OR^{12b}$ (R^{12b} は(a)水素原子、(b)請求項15記載の群(A)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(c)請求項15記載の群(B)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよい3～8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5～6員複素環との縮合環基、(d)請求項15記載の群(A)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(e)請求項15記載の群(A)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基で置換されているもよいカルバモイル基、(f) $-NR^{13b}R^{14b}$ (式中、 R^{13b} および R^{14b} はそれぞれ水素原子、請求項15記載の群(A)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基または請求項15記載の群(B)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよい3～8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5～6員複素環との縮合環基を示す。)で表わされる基または(a) $-S(R^{15b})_2$ (R^{15b} は請求項15記載の群(A)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基を示す。)で表わされる基を示す。)で表わされる基、(13) $-S(O)_nR^{16b}$ (R^{16b} は請求項15記載の群(A)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基または請求項15記載の群(B)から選ばれる1～5個の置換基で置換されているもよい3～8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5～6員複素環との縮合環基、 n^{16b} は0～2の整数を示す。)で表わされる基または(14) $-P(O)(R^{17b})_2$ (R^{17b} は水素原子またはC₁₋₁₆アルキル基を示す。)で表わされる基である請求項12記載の方法。

【請求項18】 R^{23b} が $-NR^{25b}R^{26b}$ (式中、 R^{25b} および R^{26b} はそれぞれ(1)水素原子、(2)C₁₋₆アルキル、(3)ベンゾイルで置換されているもよいC₇₋₂₀アラルキル、(4)モノもしくはジC₁₋₆アルキルカルバモイル基、(5)ハロゲン置換されているもよいC₁₋₆アルカノイル、(6)C₈₋₁₄アリールカルボニルまたは(7)C₁₋₆アルコキシカルボニルを示す。)で表わされる基または

$-N=C(R^{27b})R^{28b}$ (式中、 R^{27b} および R^{28b} はそれぞれ(1)水素原子、(2)C₁₋₆アルキル基、(3)C₁₋₆アルコキシおよびまたはヒドロキシで置換されているもよいC₆₋₁₄アリール基、(4)C₁₋₆アルコキシ基、(5)モノもしくはジC₁₋₆アルキルアミノ基または(6)ヒドロキシアミノ基を示す。)で表わされる基である請求項12記載の方法。

【請求項19】 W^b が(1) $-S(O)_nR^{40b}$ (式中、 n^{40b} は0～2の整数を、 R^{40b} はハロゲンで置換されているもよいC₁₋₆アルキル基を示す。)で表わされる基、(2)ハロゲンもしくはC₁₋₆アルキルチオで置換されているもよいC₁₋₆アルカノイル基または(3)式



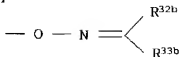
【式中、 X^{2b} は置換されているもよいハロアルキル基を、 X^{3b} は水素原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を、 Y^{2b} は窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を示すか、あるいは X^{2b} と Y^{2b} とでチオキソ基、ヒドロキシミノ基またはオキシラン環を形成してもよく、 R^{2b} と Y^{2b} とで、置換されているもよい、炭素原子、窒素原子、硫黄原子もしくはリン原子から選ばれる少なくとも一つのヘテロ原子で構成炭素原子が置換されたC₂₋₄アルキレン基またはC₂₋₄アルキレン基を形成してもよく】で表わされる基である請求項12記載の方法。

【請求項20】 X^{2b} がハロC₁₋₆アルキル基を、 X^{3b} が(1)水素原子、または(2)(i)ハロゲン、(ii)ヒドロキシ、(iii)C₁₋₆アルキルチオ基、(iv)C₁₋₆アルコキシ基、(v) $-NR^{29b}R^{30b}$ (R^{29b} および R^{30b} はそれぞれ水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルカノイルアミノ基またはC₇₋₂₀アラルキル基を示す。)で表わされる基、(vi) $-PO(OR^{31b})_2$ (R^{31b} はC₁₋₆アルキル基を示す。)で表わされる基もしくは(vii)5～6員複素環基から選ばれる置換基で1～3個置換されているもよいC₁₋₆アルキル基を、 Y^{2b} が(i)ヒドロキシ基、(2)(i)C₁₋₆アルコキシ、(ii)C₁₋₆アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)または(iii)モノもしくはジC₁₋₆アルキルアミノで置換されているもよいC₁₋₆アルコキシ基、(3)C₂₋₁₀アルケニルオキシ基、(4)C₃₋₆シクロアルキルオキシ基、(5)C₁₋₆アルキルまたはC₆₋₁₄アリールで置換されているもよいカルバモイルオキシ基、(6)ハロゲンで置換されているもよいC₁₋₆アルカノイルオキシ基、(7)ハロゲンまたはC₁₋₆アルキルで置換されているもよいC₆₋₁₄アリールオキシ基、(8)C₁₋₆アルコキシカルボニルオキシ基、(9)(i)C₁₋₆アルキル、(ii)シアノ、(iii)ハロゲン、または(iv)モノ、あるいはトリハロゲン

11

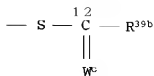
1-6アルキルで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールカルボニルオキシ基、(10)ニトロで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールオキシカルボニルオキシ基、(11)C₁₋₆アルコキシカルボニルアミノオキシ基、(12)ベンゾイルで置換されていてもよいC₇₋₂₀アラキルオキシ基、(13)式

【化10】



〔式中、R^{32b}およびR^{33b}はそれぞれ(i)ハロゲンで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基または(ii)C₁₋₆アルキル基を示す。〕で表わされる基、(14)式—OSi(R^{34b})₃〔式中、R^{34b}はC₁₋₆アルキル基を示す。〕で表わされる基、(15)(i)C₁₋₆アルキル、(ii)C₁₋₆アルキルチオおよび(iii)オキソから選ばれる置換基で1〜3個置換されていてもよい5〜6員複素環—オキシ基もしくは5〜6員複素環とベンゼン環との縮合環基、(16)(i)C₁₋₆アルキル、(ii)アセチルアミノ、(iii)オキソ、(iv)ハロゲンおよび(v)ヒドロキシから選ばれる置換基で1〜3個置換されていてもよい5〜6員複素環基またはそのベンゼン環もしくは5〜6員複素環との縮合環基、(17)式—NR^{35b}R^{36b}〔式中、R^{35b}およびR^{36b}はそれぞれ(i)水素原子、(ii)ヒドロキシル基、(iii)シアノ、ハロゲン、C₁₋₆アルコキシカルボニルまたはモノ—もしくはジ—C₁₋₆アルキルアミノで置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、(iv)ハロゲンまたはC₁₋₆アルキルで1〜3個置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基、(v)ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイル基、(vi)C₁₋₆アルコキシ基、(vii)C₇₋₂₀アラキルオキシ基、(viii)C₁₋₆アルコキシカルボニル基、(ix)モノ—もしくはジ—C₁₋₆アルキルカルボニル基、(x)C₁₋₆アルキル基、(xi)ハロゲンで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールスルホニル基、(xii)ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アルキルスルホニル基、(xiii)ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アルキルスルフィニル基、(xiv)C₁₋₆アルキルで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールスルホニルアミノ基、(xv)C₁₋₆アルカノイルアミノ基または(xvi)C₁₋₆アルコキシカルボニルアミノ基を示す。〕で表わされる基、(18)式—N=C(R^{37b})R^{38b}〔式中、R^{37b}およびR^{38b}はそれぞれ水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基またはC₆₋₁₄アリール基を示す。〕で表わされる基、(19)ハロゲンまたはC₁₋₆アルコキシカルボニルで置換されていてもよいC₁₋₆アルキルチオ基、(20)C₆₋₁₄アリールチオ基、(21)式

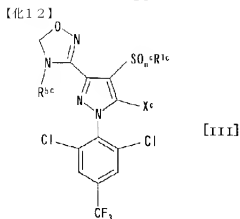
【化11】



〔式中、W^cはOまたはSを、R^{39b}は式—NR^{40b}R^{41b}(R^{40b}およびR^{41b}はそれぞれC₁₋₆アルキル基を示す。)で表わされる基、C₁₋₆アルキル基またはC₁₋₆アルコキシ基を示す。〕で表わされる基、(22)C₆₋₁₄アリールスルホニル基、(23)C₁₋₆アルキルスルホニル基、(24)C₁₋₆アルキルスルフィニル基、(25)(i)シアノ、(ii)C₁₋₆アルコキシカルボニルおよび(iii)(a)ハロゲンで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールおよび/または(b)C₁₋₆アルキルで置換されていてもよいカルボニル基から選ばれる1〜3個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、または(26)式—PO(R^{42b})₂〔式中、R^{42b}はC₁₋₆アルコキシ基を示す。〕で表わされる基を、またはR^{2b}とY^{2b}とで式—Z^{2b}—CR^{73b}R^{44b}—NR^{45b}—〔式中、R^{43b}、R^{44b}およびR^{45b}は水素またはC₁₋₆アルキル基を、Z^{2b}は酸素原子または—NR^{46b}—(R^{46b}は水素またはC₁₋₆アルキル基を示す。)で表わされる基を示す。〕で表わされる基、式—Z^{2b}—CR^{47b}=N—〔式中、R^{47b}は水素、C₁₋₆アルキル基またはアミノ基を、Z^{2b}は前記と同意義を示す。〕で表わされる基、式—N=C(R^{48b})—NR^{49b}—〔式中、R^{48b}およびR^{49b}は前記と同意義を示す。〕で表わされる基、または式Z^{2b}—C(=W^d)—NR^{44b}—〔式中、R^{44b}およびZ^{2b}は前記と同意義を、W^dは酸素原子または硫黄原子を示す。〕で表わされる基を示す請求項19記載の方法。

【請求項21】農薬活性成分が(1)1—〔N—(6-クロロ-3-ビリジルメチル)—N-エチルアミノ〕—1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン、(2)1—(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)—3-メチル-2-ニトログアニジン、(3)1—(6-クロロ-3-ビリジルメチル)—N-ニトロ-1-イミダゾリジン-2-イリデンアミン、(4)N—(6-クロロ-3-ビリジルメチル)—N'-シアノ-N-メチルアセトアミン、(5)1—(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)—3, 5-ジメチル-2-ニトロイミノヘキサヒドロ-1, 3, 5-トリアジン、(6)1—(3-テトラヒドロフラニルメチル)—3-メチル-2-ニトログアニジン、(7)3—(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)—5-メチル-4-ニトロイミノ-1, 3, 5-パーヒドロオキサジアジン、(8)3—(2-クロロ-5-ビリジルメチル)—1, 3-チアゾリジン-2-イリデンシアナミドまたは(9)5-アミノ-1—(2, 6-ジクロロ- α , α , α -トリフルオロ-p-トルル)—4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール-3-カルボニルである請求項1記載の方法。

50 【請求項22】農薬活性成分が式



〔式中、 R^{10} は C_{1-6} アルキル基または C_{1-6} ハロアルキル基を、 n^6 は0、1または2を、 X^6 は $-NR^{10}R^{10}$ 、 $-N=CHOR^{10}$ (R^{10} および R^{10} はそれぞれ水素原子または C_{1-6} アルキル基を、 R^{11} は C_{1-6} アルキル基を示す)または $-N=CHNR^{10}R^{10}$ (R^{10} および R^{10} はそれぞれ水素原子または C_{1-6} アルキル基を示す)を、 R^{10} は置換されていてもよいアルキル基または置換されていてもよいアルキル基を示す〕で表わされる化合物またはその塩である請求項1記載の方法。

【請求項23】 R^{10} が置換されていてもよいカルボモイル基である請求項2記載の方法。

【請求項24】 R^{10} が(1) C_{1-6} アルコキシで1〜3個置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、(2) C_{1-6} アルキルで1もしくは2個置換されていてもよいアミノ、 C_{1-6} アルコキシ、フェニルまたはハロゲン原子で1〜3個置換されていてもよい C_{2-10} アルカノイル基、(3) C_{4-10} シクロアルカニル基、(4)フェニルで1〜2個置換されていてもよい C_{8-10} アルケニルカルボニル基、(5)ベンゾイル基、(6) C_{1-6} アルキル、 C_{8-9} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルケニル、フェニル、ベンジル、 C_{1-6} アルキルで1もしくは2個置換されていてもよいアミノ、環状アミノ、ヒドロキシル、ホルミルまたは C_{1-6} アルコキシで1もしくは2個置換されていてもよいカルボモイル基、(7)環状アミノカルボニル基または(8) C_{1-6} アルコキシカルボニル基である請求項2記載の方法。

【請求項25】 X^6 が $-NH_2$ または $-N=CHOR^{10}$ (R^{10} は C_{1-6} アルキル基を示す)である請求項2記載の方法。

【請求項26】 R^{10} がトリフルオロメチル基である請求項2記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、農業活性成分、特に、非有機リン・非カーバメイト系の浸透性殺虫化合物を被作物の育苗培土に混和する新しい害虫防除方法に関する。

【0002】

【従来の技術】一年生作物では一般に、育苗期の病害虫防除、水管理、施肥、定植前の耕耘、施肥などの圃場管理、定植後生育期の病害虫防除、施肥など、播種から収穫までの間に多大な労力を要する作業が必要とされる。その中の害虫防除に限ってみても、一作期中に数回から十数回の薬剤散布が行われることが多く、労力面で農家に大きな負担となっているばかりでなく、散布作業者が薬剤被曝する危険性も伴っている。更に、害虫防除剤の散布が必要なのは、高温時が多く、マスク、作業服の着用は多少とも苦痛を伴い、いわゆる3K（危険、汚い、きつい）の作業となっている。更に、薬剤の多回散布は、環境への化学物質の拡散という点においても好ましくない。このように問題のある害虫防除作業を少しでも簡便にし、一作期中の薬剤処理回数をおよび処理量を低減する方法として、農業では定植時の粒間植穴処理の技術が開発され、好成績をあげている。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】植穴処理は一株ずつ処理するため、処理作業に多くの時間と労力を必要とし、特に大規模生産農家では大きな負担となっている。そのため、定植と薬剤処理を同時に行う自動移植機が開発されているが、新たな機械購入は農家にとって多大な投資を必要とする。また、上記植穴処理は、定植後の害虫防除を目的とした方法であり、育苗期間中は、通常の薬剤散布による防除が必要という問題が残っている。育苗期間の長い作物では、育苗期間中に数回の薬剤散布が必要な場合があり、一度だけの薬剤処理で播種時から本圃定植後の生育期までをカバーできる害虫防除方法の開発が望まれていた。

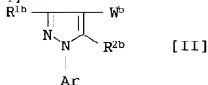
【0004】

【課題を解決するための手段】このような状況のなかで、本発明者は、蔬菜類又は花き類の苗植え付け前に、後述の式〔1〕で表わされる浸透性殺虫化合物を含有する薬液を、苗床に高濃度高薬量施用することにより、一度だけの処理で、育苗後期の育苗期間中ばかりか、定植後も害虫を防除できる方法を見いだした（特開平9-124402）。そして、更に研究を重ねた結果、播種時に用いる育苗培土あるいは仮植時に用いる育苗培土に農業活性成分を混和することによって、更に作業効率の大幅な改善を図ることができることを見いだし、本発明を完成するに至った。すなわち、本発明は〔1〕播種または仮植前に農業活性成分を混和した育苗培土を充填した育苗容器で育苗することを特徴とし、イネを除く被子植物に対する害虫の防除方法、〔2〕被子植物が双子葉植物またはユリ目植物である上記〔1〕記載の方法、〔3〕被子植物がケシ目、アカガシ目、バラ目、セリ目、ツバキ目、アオイ目、シソ目、ウリ目、キキョウ目、イソマツ目、モクセイ目、サクラソウ目またはユリ目植物である上記〔1〕記載の方法、〔4〕被子植物が

17

C₃₋₁₀シクロアルキル基、C₂₋₁₀アルケニル基、C₂₋₁₀アルキニル基、C₈₋₁₀シクロアルケニル基、C₆₋₁₀アリール基またはC₇₋₁₀アリール基である上記〔5〕記載の方法、〔10〕X^aがシアノ基、ニトロ基、C₁₋₄アルコキシカルボニル基、ヒドロキシカルボニル基、C₆₋₁₀アリールオキシカルボニル基、3~6員複素環オキシカルボニル基、ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₄アルキルスルホニル基、スルファモイル基、ジ-C₁₋₄アルコキシホスホリル基、ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アシル基、C₆₋₁₀アリールカルボニル基、カルバモイル基またはC₁₋₄アルキルスルホニルオカルバモイルである上記〔5〕記載の方法、〔11〕R^{1a}が水素原子、C₁₋₆アルキル、ホルミル、C₁₋₄アルキルカルボニル、C₆₋₁₀アリールカルボニル、C₁₋₄アルキルスルホニルまたはハロゲンで置換されていてもよいまたは6員複素環基で置換されたC₁₋₆アルキルであり、R^{2a}が水素原子、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキレンまたはR^{3a}と結合する-CH₂-N(Z^{2a})-CH₂-(Z^{2a}は水素原子、C₁₋₆アルキルまたはC₁₋₆アルキルカルボニルを示す。)もしくは-CH₂-O-CH₂-であり、R^{3a}がC₁₋₆アルキル、-S-R^{41a}(R^{41a}は水素原子、C₁₋₆アルキルまたはC₁₋₄アルキルカルボニルを示す。)、-N(R^{51a})(R^{51a}はR^{51a}およびR^{51a}は同一または異なって、水素またはC₁₋₆アルキルを示す。)、またはR^{2a}と結合するC₁₋₄アルキレン、-S-もしくは-N(Z^{3a})-(Z^{3a}はZ^{2a}と同意義を示す。)であり、Y^aが=Nまたは=CH-であり、X^aがニトロまたはシアノである上記〔5〕記載の方法、〔12〕農薬活性成分が式〔II〕

【化14】



〔式中、Arは置換されていてもよい芳香族炭化水素基または置換されていてもよい芳香族複素環基を、R^{1b}は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、カルボキシル、置換されていてもよい炭化水素基、硫黄原子を介する基または式

【化15】



〔式中、X^{1b}は水素原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を、Y^{1b}

18

は水素原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を示すか、あるいはX^{1b}とY^{1b}とが合わさって、

【化16】



で表わされる基が置換されていてもよい含窒素複素環基を示す。)で表わされる基を、R^{2b}は水素原子、ハロゲン原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を、W^bはハロゲン原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を示す。)で表わされる化合物(以下、式〔II〕で表わされる化合物を化合物〔II〕と略称する場合がある。)またはその塩である上記〔1〕記載の方法、〔13〕Arが(i)ヒドロキシ、アミノ、モノ-もしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ、C₁₋₆アルコキシまたはハロゲン原子で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、(2)C₁₋₆アルキルもしくはC₁₋₆アルカノイルでモノ-もしくはジ-置換されていてもよいアミノ基、(3)ヒドロキシル基、(4)カルボキシ基、(5)ニトロ基、(6)SF₆、(7)C₁₋₆アルコキシ基、(8)C₁₋₆アルカノイルオキシ基、(9)シアノ基および(10)ハロゲン原子から選ばれる1~6個の置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄芳香族炭化水素基または5~8員芳香族複素環基またはそのC₆₋₁₆環状炭化水素または5~6員複素環との縮合環基である上記〔12〕記載の方法、〔14〕Arがハロゲン、C₁₋₆アルキルおよびモノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化C₁₋₆アルキルから選ばれる1~5個の置換基で置換されたフェニル基である上記〔12〕記載の方法、〔15〕R^{1b}が(i)水素原子、(2)ハロゲン原子、(3)ニトロ基、(4)シアノ基、(5)カルボキシ基、(6) (i)ニトロ、(ii)ヒドロキシ、(iii)オキシ、(iv)チオキシ、(v)シアノ、(vi)カルバモイル、(vii)カルボキシル、(viii)C₁₋₁₅アシル基、(ix)スルホ基、(x)ハロゲン原子、(xi)モノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化されていてもよい(a)C₁₋₈アルコキシおよび(b)C₈₋₁₄アリールオキシから選ばれるC₁₋₁₄炭化水素オキシ基、(xii)-S(O)_{n1b}R^{3b}(式中、n_{1b}は0、1または2を、R^{3b}はC₁₋₆アルキルおよびC₈₋₁₄アリールから選ばれるC₁₋₁₄炭化水素基を示す。)、(xiii)C₁₋₆アルキルもしくはC₁₋₆アルキル-カルボニルでモノ-もしくはジ-置換されていてもよいアミノ、(xiv)C₁₋₄アルキルでモノ-もしくはジ-置換されていてもよいヒドロゾノおよび(xv) (a)ハロゲン原子、(b)C₁₋₄アルキルおよび(c)モノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化フェニルから選ばれる1~4個の置換基を有してい

てもよい5または6員複素環基からなる群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(7)~S(O)^{n^{4b}}R^{10b}〔R^{10b}は上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基または(i)モノ、ジもしくはトリハロゲン化されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(ii)C₁₋₁₄炭化水素オキシ基、(iii)C₁₋₁₅アシル基、(iv)C₁₋₁₅アシルオキシ基、(v)カルボキシル基、(vi)C₁₋₄アルキルでモノもしくはジ置換されているもよいカルボニル基、(vii)環状アミノカルボニル基、(viii)ハロゲン原子、(ix)オキシ基、(x)アミノ基、(xi)C₁₋₆アルキルで置換されているもよいミノ基、(xii)C₁₋₈アルキル、カルバモイルもしくはN-モノもしくはN,N-ジ-C₁₋₄アルキル-カルバモイルでモノもしくはジ置換されているもよいアミノ基、(xiii)3~6員複素環オキシ基、(xiv)C₁₋₆アルカノイルアミド基、(xv)ベンズアミド、(xvi)C₁₋₅アルケレンジオキシ基、(xvii)-B(OH)₂、(xviii)ヒドロキシル基、(xix)ニトロ基、(xx)シアノ基、(xxi)-S(O)_{n^{4b}}R^{11b}〔式中、n^{4b}は0、1または2を、R^{11b}は水素原子またはC₁₋₁₄炭化水素基を示す。〕および(xxi)C₁₋₆アルキルでモノもしくはジ置換されているもよいスルファモイル基からなる群(B)から選ばれる1~6個の置換基で置換されているもよい3~8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環基を、n^{4b}は0~2の整数を示す。〕で表わされる基、または(8)式

【化17】



〔式中、Y^{1b}は(i)水素原子、(ii)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(iii)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₄アシル基、(iv)シアノ基、(v)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基で置換されているもよいカルボニル基、(vi)アミノ基、(vii)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよい炭素原子に結合手を有する3~8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環基、(viii)ニトロ基、(ix)-NR^{13b}R^{14b}〔式中、R^{13b}およびR^{14b}はそれぞれ(a)水素原子、(b)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(c)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₄アシル基、(d)上記群(A)から選ばれる1~5個の置

換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基で置換されているもよいカルボニル基、(e)上記群(B)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよい3~8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環基、(f)ヒドロキシル基、(g)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基オキシ基または(h)-S(O)^{n^{2b}}R^{6b}〔R^{6b}は水素原子または上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基を、n^{2b}は1~2の整数を示す。〕で表わされる基、(x)上記群(B)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよい、窒素原子に結合手を有する3~8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環基または(xi)-N=C(R^{7b})R^{8b}〔R^{7b}およびR^{8b}はそれぞれ水素原子、上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素オキシ基または-NR^{9b}R^{10b}〔R^{9b}およびR^{10b}はそれぞれ水素原子、ヒドロキシル基または上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基を示す。〕で表わされる基、(xii)-OR^{12b}〔R^{12b}は(a)水素原子、(b)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(c)上記群(B)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよい3~8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環基、(d)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₄アシル基、(e)上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基で置換されているもよいカルボニル基、(f)-N(R^{13b})R^{14b}〔式中、R^{13b}およびR^{14b}はそれぞれ水素原子、上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基または上記群(B)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよい3~8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環基を示す。〕で表わされる基または(g)-SiR^{15b}₃〔R^{15b}は上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基を示す。〕で表わされる基、(xiii)-S(O)_{n^{4b}}R^{16b}〔R^{16b}は上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよいC₁₋₂₀炭化水素基または上記群(B)から選ばれる1~5個の置換基で置換されているもよい3~8員複素環基またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環基を、n^{4b}は0~2の整数を示す。〕で表わされる基または(xiv)-PO(OR^{17b})₂〔R^{17b}は水素原子またはC₁₋₁₅アルキル基を示す。〕で表わされる基を、Y^{1b}は上記X^{1b}と同意義を示すか、あるいは

21

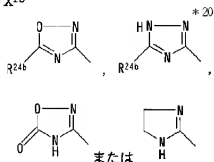
X^{1b}とY^{1b}とが合わさって、

【化18】



で表わされる基が、上記群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基またはオキシ基で1~3個置換されていてもよい含窒素5~8員複素環系を示す。)で表わされる基である上記【12】記載の方法、(16)R^{1b}がシアノ基または式

【化19】



(R^{24b}は水素原子またはC₁₋₆アルキル基を示す。)を形成する基を示す。)で表わされる基である上記【12】記載の方法、(17)R^{2b}が(1)水素原子、(2)上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(3)上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₄アシル基、(4)シアノ基、(5)上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基で置換されていてもよいカルバモイル基、(6)アミジノ基、(7)上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよい炭素原子に結合手を有する3~8員複素環系またはそのC₆₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環系、(8)ニトロ基、(9)-NR^{2b}R^{2b}(式中、R^{2b}およびR^{2b}はそれぞれ(a)水素原子、(b)上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(c)上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₄アシル基、(d)上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素

22

*【式中、X^{1b}は-NR^{20b}R^{21b}(R^{20b}およびR^{21b}はそれぞれ水素原子、ヒドロキシ、C₁₋₆アルカノイルまたはC₁₋₆アルキルを示す。)で表わされる基を、Y^{1b}は水素原子、ヒドロキシル基、C₁₋₆アルコキシでモノーもしくはジ-置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子でモノー、ジ-もしくはトリ-置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイルオキシ基、モノーもしくはジ-C₁₋₆アルキル-カルボニルオキシ基、C₁₋₆アルコキシ-カルボニルオキシ基、C₁₋₆アルキルで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール-カルボニルオキシ基、式-NR^{22b}R^{23b}(式中、R^{22b}およびR^{23b}はそれぞれ水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルカノイル基またはC₁₋₆アルコキシ-カルボニル基を示す。)で表わされる基、C₁₋₆アルキル基、もしくはX^{1b}とY^{1b}とが合わさって

【化20】

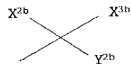
30※素基で置換されていてもよいカルバモイル基、(e)上記【15】記載の群(B)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよい3~8員複素環系またはそのC₅₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環系、(f)ヒドロキシル基、(g)上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基オキシ基または(h)-S(O)ⁿR^{2b}(R^{2b}は水素原子または上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基を、n^{2b}は1~2の整数を示す。)で表わされる基を示す。)で表わされる基、(10)上記【15】記載の群(B)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよい、窒素原子に結合手を有する3~8員複素環系またはそのC₆₋₁₀環状炭化水素もしくは5~6員複素環との縮合環系または(11)-N=C(R^{7b})R^{2b}[R^{7b}およびR^{2b}はそれぞれ水素原子、上記【15】記載の群(A)から選ばれる1~5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基または-NR^{9b}R^{10b}(R^{9b}およびR^{10b}はそれぞれ水素原

23

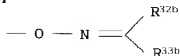
子、ヒドロキシル基または上記〔15〕記載の群(A)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基を示す。)で表わされる基、(12)−OR^{15b}〔R^{15b}は(a)水素原子、(b)上記〔15〕記載の群(A)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基、(c)上記〔15〕記載の群(B)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよい3〜8員複素環基またはそのC₆₋₁₆環状炭化水素もしくは5〜6員複素環との縮合環基、(d)上記〔15〕記載の群(A)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₄アシル基、(e)上記〔15〕記載の群(A)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基で置換されていてもよいカルバモイル基、(f)−NR^{15b}R^{14b}〔式中、R^{15b}およびR^{14b}はそれぞれ水素原子、上記〔15〕記載の群(A)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基または上記〔15〕記載の群(B)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよい3〜8員複素環基またはそのC₆₋₁₆環状炭化水素もしくは5〜6員複素環との縮合環基を示す。)で表わされる基または(g)−SiR^{15b}₃〔R^{15b}は上記〔15〕記載の群(A)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基を示す。〕で表わされる基、(13)−S(O)_nR^{16b}〔R^{16b}は上記〔15〕記載の群(A)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₂₀炭化水素基または上記〔15〕記載の群(B)から選ばれる1〜5個の置換基で置換されていてもよい3〜8員複素環基またはそのC₆₋₁₆環状炭化水素もしくは5〜6員複素環との縮合環基を、n^{6b}は0〜2の整数を示す。〕で表わされる基または(14)−PO(R^{17b})₂〔R^{17b}は水素原子またはC₁₋₁₆アルキル基を示す。〕で表わされる基である上記〔12〕記載の方法、〔18〕R^{25b}が−NR^{25b}R^{26b}〔式中、R^{25b}およびR^{26b}はそれぞれ(1)水素原子、(2)C₁₋₆アルキル、(3)ベンゾイルで置換されていてもよいC₇₋₂₂アラキル、(4)モノーもしくはジ−C₁₋₆アルキル−カルバモイル基、(5)ハロゲン置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイル、(6)C₈₋₁₄アリールカルボニルまたは(7)C₁₋₆アルコキシカルボニルを示す。〕で表わされる基または−N=C(R^{27b})R^{28b}〔式中、R^{27b}およびR^{28b}はそれぞれ(1)水素原子、(2)C₁₋₆アルキル基、(3)C₁₋₄アルコキシおよび/またはヒドロキシで置換されていてもよいC₈₋₁₄アリール基、(4)C₁₋₆アルコキシ基、(5)モノーもしくはジ−C₁₋₆アルキルアミノ基または(6)ヒドロキシアミノ基を示す。〕で表わされる基である上記〔12〕記載の方法、〔19〕W^bが(1)−S(O)_n^{5b}R^{48b}〔式中、n^{5b}は0〜2の整数を、R^{48b}はハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基を示す。〕で表わされる基、(2)ハロゲンもしくはC₁₋₆アルキルチオで置

24

換されていてもよいC₁₋₆アルカノイル基または(3)式【化21】

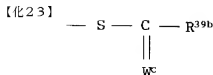


〔式中、X^{2b}は置換されていてもよいハロアルキル基を、X^{3b}は水素原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を、Y^{2b}は窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を示すか、あるいはX^{2b}とY^{2b}とでチオキソ基、ヒドロキシミノ基またはオキシラン環を形成してもよく、R^{2b}とY^{2b}とで、置換されていてもよい、酸素原子、窒素原子、硫黄原子もしくはリン原子から選ばれる少なくとも一つのヘテロ原子で構成炭素原子が置換されたC₂₋₄アルキレン基またはC₂₋₄アルケニレン基を形成してもよい〕で表わされる基である上記〔12〕記載の方法、〔20〕X^{2b}がハロC₁₋₆アルキル基を、X^{3b}が(1)水素原子、または(2)ハロゲン、(ii)ヒドロキシ、(iii)C₁₋₆アルキルチオ基、(iv)C₁₋₆アルコキシ基、(v)−NR^{25b}R^{26b}〔R^{25b}およびR^{26b}はそれぞれ水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルカノイルアミノ基またはC₇₋₂₀アラキル基を示す。〕で表わされる基、(vi)−PO(OR^{21b})₂〔R^{21b}はC₁₋₆アルキル基を示す。〕で表わされる基もしくは(vii)5〜6員複素環基から選ばれる置換基で1〜3個置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基を、Y^{2b}が(1)ヒドロキシル基、(2)(i)C₁₋₆アルコキシ、(ii)C₁₋₆アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)または(iii)モノーもしくはジ−C₁₋₆アルキルアミノで置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシ基、(3)C₂₋₁₀アルケニルオキシ基、(4)C₉₋₆シクロアルキルオキシ基、(5)C₁₋₆アルキルまたはC₈₋₁₄アリールで置換されていてもよいカルバモイルオキシ基、(6)ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイルオキシ基、(7)ハロゲンまたはC₁₋₆アルキルで置換されていてもよいC₈₋₁₄アリールオキシ基、(8)C₁₋₆アルコキシカルボニルオキシ基、(9)(i)C₁₋₆アルキル、(ii)シアノ、(iii)ハロゲン、または(iv)モノー、ジーもしくはトリハロゲンC₁₋₆アルキルで置換されていてもよいC₈₋₁₄アリールカルボニルオキシ基、(10)ニトロで置換されていてもよいC₈₋₁₄アリールオキシカルボニルオキシ基、(11)C₁₋₆アルコキシカルボニルアミノオキシ基、(12)ベンゾイルで置換されていてもよいC₇₋₂₀アラキルカルボニル、(3)式【化22】



〔式中、R^{32b}およびR^{33b}はそれぞれ(i)ハロゲンで置

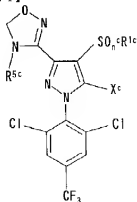
換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基または(ii)C₁₋₆アルキル基を示す。〕で表わされる基、(14)式—OSi(R^{24b})₃〔式中、R^{24b}はC₁₋₆アルキル基を示す。〕で表わされる基、(15)(i)C₁₋₆アルキル、(ii)C₁₋₆アルキルチオおよび(iii)オキシから選ばれる置換基で1〜3個置換されていてもよい5〜6員複素環—オキシ基もしくは5〜6員複素環とベンゼン環との縮合環基、(16)(i)C₁₋₆アルキル、(ii)アセチルアミノ、(iii)オキソ、(iv)ハロゲンおよび(v)ヒドロキシから選ばれる置換基で1〜3個置換されていてもよい5〜6員複素環基またはそのベンゼン環もしくは5〜6員複素環との縮合環基、(17)式—NR^{25b}R^{26b}〔式中、R^{25b}およびR^{26b}はそれぞれ(i)水素原子、(ii)ヒドロキシル基、(iii)シアノ、ハロゲン、C₁₋₆アルコキシカルボニルまたはモノもしくはジ—C₁₋₆アルキルアミノで置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、(iv)ハロゲンまたはC₁₋₆アルキルで1〜3個置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基、(v)ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイル基、(vi)C₁₋₆アルコキシ基、(vii)C₇₋₂₀アラルキルオキシ基、(viii)C₁₋₆アルコキシカルボニル基、(ix)モノもしくはジ—C₁₋₆アルキルカルバモイル基、(x)C₂₋₁₆アルキル基、(xi)ハロゲンで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールスルホニル基、(xii)ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アルキルスルホニル基、(xiii)ハロゲンで置換されていてもよいC₁₋₆アルキルスルフィニル基、(xiv)C₁₋₆アルキルで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールスルホニルアミノ基、(xv)C₁₋₆アルカノイルアミノ基または(xvi)C₁₋₆アルコキシカルボニルアミノ基を示す。〕で表わされる基、(18)式—N=C(R^{27b}R^{28b})〔式中、R^{27b}およびR^{28b}はそれぞれ水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基またはC₆₋₁₄アリール基を示す。〕で表わされる基、(19)ハロゲンまたはC₁₋₆アルコキシカルボニルで置換されていてもよいC₁₋₆アルキルチオ基、(20)C₆₋₁₄アリールチオ基、(21)式



〔式中、W^cはOまたはSを、R^{29b}は式—NR^{40b}R^{41b}(R^{40b}およびR^{41b}はそれぞれC₁₋₆アルキル基を示す。)で表わされる基、C₁₋₆アルキルまたはC₁₋₆アルコキシ基を示す。〕で表わされる基、(22)C₆₋₁₄アリールスルホニル基、(23)C₁₋₆アルキルスルホニル基、(24)C₁₋₆アルキルスルフィニル基、(25)(i)シアノ、(ii)C₁₋₆アルコキシカルボニルおよび(iii)(a)ハロゲンで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールおよび/または(b)C₁₋₆アルキルで置換されていてもよいカルバモイル基から選ばれる1〜3個の置換基で置換されていてもよ

いC₁₋₆アルキル基、または(26)式—PO(R^{42b})₂(式中、R^{42b}はC₁₋₆アルコキシ基を示す。)で表わされる基を、またはR^{22b}とY^{22b}とで式—Z^{2b}—C(R^{43b}R^{44b}—NR^{45b})〔式中、R^{43b}、R^{44b}およびR^{45b}は水素またはC₁₋₆アルキル基を、Z^{2b}は酸素原子または—NR^{46b}—(R^{46b}は水素またはC₁₋₆アルキル基を示す。)で表わされる基を示す。〕で表わされる基、式—Z^{2b}—C(R^{47b})=N—〔式中、R^{47b}は水素、C₁₋₆アルキル基またはアミノ基を、Z^{2b}は前記と同意義を示す。〕で表わされる基、式—N=C(R^{48b}—NR^{49b})〔式中、R^{48b}およびR^{49b}は前記と同意義を示す。〕で表わされる基、または式—Z^{2b}—C(W⁴)—NR^{44b}〔式中、R^{44b}およびZ^{2b}は前記と同意義を、W⁴は酸素原子または硫黄原子を示す。〕で表わされる基を示す上記〔19〕記載の方法、〔21〕農薬活性成分が(1)1—〔N—(6—クロロ—3—ビリジメチル)—N—エチルアミノ〕—1—メチルアミノ—2—ニトロエチレン、(2)1—(2—クロロ—5—チアゾリルメチル)—3—メチル—2—ニトログアニジン、(3)1—(6—クロロ—3—ビリジメチル)—N—ニトロ—イミダゾリジン—2—イリデンアミン、(4)N—(6—クロロ—3—ビリジメチル)—N¹—シアノ—N—メチルセトアミジン、(5)1—(2—クロロ—5—チアゾリルメチル)—3, 5—ジメチル—2—ニトロイミノ—ヘキサヒドロ—1, 3, 5—トリアジン、(6)1—(3—テトラヒドロフランメチル)—3—メチル—2—ニトログアニジン、(7)3—(2—クロロ—5—チアゾリルメチル)—5—メチル—4—ニトロイミノ—1, 3, 5—バ—ヒドロオキサジアジン、(8)3—(2—クロロ—5—ビリジメチル)—1, 3—チアゾリジン—2—イリデンシアナメチルまたは(9)5—アミノ—1—(2, 6—ジクロロ—α, α, α—トリフルオロ—p—トリル)—4—トリフルオロメチルスルフィニルビラゾール—3—カルボニルである上記〔1〕記載の方法、〔22〕農薬活性成分が式

【化24】



[III]

〔式中、R^{1c}はC₁₋₆アルキル基またはC₆₋₈アリール基を、n⁴は0, 1または2を、X^cは—NR^{2c}R^{3c}、

$\text{N}=\text{CHOR}^{\text{R}^4}$ (R^{R^4} および R^{R^5} はそれぞれ水素原子または C_{1-6} アルキル基を、 R^{R^6} は C_{1-6} アルキル基を示す)または $\text{N}=\text{CHNR}^{\text{R}^5}\text{R}^{\text{R}^7}$ (R^{R^5} および R^{R^7} はそれぞれ水素原子または C_{1-6} アルキル基を示す)を、 R^{R^6} は置換されていてもよいアルキル基または置換されていてもよいシル基を示す)で表わされる化合物またはその塩である上記〔1〕記載の方法、〔23〕 R^{R^6} が置換されていてもよいカルバモイル基である上記〔22〕記載の方法、〔24〕 R^{R^6} が(1) C_{1-6} アルコキシで1〜3個置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、(2) C_{1-6} アルキルで1もしくは2個置換されていてもよいアミノ、 C_{1-6} アルコキシ、フェニルまたはハロゲン原子で1〜3個置換されていてもよい C_{2-10} アルカノイル基、(3) C_{1-10} シクロアルカノイル基、(4)フェニルで1〜2個置換されていてもよい C_{3-10} アルケニルカルボニル基、(5)ペンゾイル基、(6) C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、フェニル、ベンジル、 C_{1-6} アルキルで1もしくは2個置換されていてもよいアミノ、環状アミノ、ヒドロキシル、ホルミルまたは C_{1-6} アルコキシで1もしくは2個置換されていてもよいカルバモイル基、(7)環状アミノカルボニル基または(8) C_{1-6} アルコキシカルボニル基である上記〔22〕記載の方法、〔25〕 X^{R^6} が $\text{N}=\text{H}_2$ または $\text{N}=\text{CHOR}^{\text{R}^4}$ (R^{R^4} は C_{1-6} アルキル基を示す)である上記〔22〕記載の方法、および〔26〕 R^{R^6} がトリフルオロメチル基である上記〔22〕記載の方法に関する。

【0005】本発明で用いられる農薬活性成分としてはカルバミン酸エステル(例、カルボスルファン、ペンフラカルブなど)、有機リン化合物(例、アセフエート、ダイアジノン、ジメトエート、エチルチオメトン、モノフロトホスなど)、特開平3-157308号公報に記載のグアニジン誘導体や特開平2-288859号公報、特開平2-288860号公報に記載のニトロ化合物、特開昭61-267575号公報に記載のニトロイミノ化合物、特開昭60-218386号および特開昭61-178981号公報に記載のニトロメチレン誘導体、その他、特開昭62-81382号、特開平2-235881号、WO91/04965、特開平8-311036および特開平9-150363等に記載されている殺虫化合物が挙げられる。これらの中で上記した化合物〔I〕、〔II〕またはその塩が好ましい。さらに上記した化合物〔III〕またはその塩も好ましい。

【0006】化合物〔I〕において、 R^{R^1} で示される炭化水素基としては、たとえばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシル等の C_{1-6} アルキル、たとえばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどの C_{3-10} シクロアルキル、たとえばビニル、アリル、2-メチルアリル、2-ブテニ

ル、3-ブテニル、3-オクテニルなどの C_{2-10} アルケニル、たとえばエチニル、2-プロピニル、3-ヘキシニルなどの C_{2-10} アルキニル、たとえばシクロプロピニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニルなどの C_{3-10} シクロアルケニル、たとえばフェニル、ナフチルなどの C_{6-10} アリール、たとえばフェニル- C_{1-4} アルキル(例、ベンジル、フェニルエチル)などの C_{7-10} アラール基などが挙げられる。

【0007】 R^{R^2} で示されるアルキル基としては、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリルなどの C_{1-6} アルキル-カルボニル、ベンゾイルなどの C_{6-10} アリール-カルボニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、ブチルスルホニルなどの C_{1-4} アルキルスルホニルなどが挙げられる。 R^{R^3} で示される置換されていてもよい複素環基で置換されたアルキル基の複素環基としては、酸素原子、硫黄原子、窒素原子などのヘテロ原子を1〜5個含む3〜6員環またはそのベンゼン環もしくは複素原子、硫黄原子、窒素原子などのヘテロ原子を1〜5個含む3〜6員環との縮合環基が挙げられ、その具体例としてはチエニル(例、2-または3-チエニル)、フリル(例、2-または3-フリル)、ピロリル(例、1-, 2-または3-ピロリル)、ビリジル(例、2-, 3-または4-ビリジル)、オキサゾリル(例、2-, 4-または5-オキサゾリル)、チアゾリル(例、2-, 4-または5-チアゾリル)、ピラゾリル(例、1-, 3-, 4-または5-ピラゾリル)、イソキサゾリル(例、3-, 4-または5-イソキサゾリル)、イソチアゾリル(例、3-, 4-または5-イソチアゾリル)、オキサジアゾリル(例、1-, 2-, 3-オキサジアゾール-4-または5-イール、1-, 2-, 4-オキサジアゾール-3-または5-イール、1-, 2-, 5-オキサジアゾール-3-イール、1, 3-, 4-オキサジアゾール-2-イール)、チアジアゾリル(例、1-, 2-, 3-チアジアゾール-4-または5-イール、1-, 2-, 4-チアジアゾール-3-または5-イール、1-, 2-, 5-チアジアゾール-3-イール、1, 3-, 4-チアジアゾール-2-イール)、トリアゾリル(例、1-, 2-, 3-トリアゾール-1-, 4-または5-イール、1-, 2-, 4-トリアゾール-1-, 3-, 4-または5-イール)、テトラゾリル(例、1Hまたは2H-テトラゾリル)、窒素原子が酸化されたビリジル(例、2-, 3-または4-ビリジル-N-オキシド)、ビリミジニル(例、2-, 4-または5-ビリミジニル)、窒素原子の一方または両方が酸化されたビリミジニル(例、2-, 4-, 5-または6-ビリミジニル-N-オキシド)、ビリダジニル(例、3-または4-ビリダジニル)、窒素原子の一方または両方が酸化されたビリダジニル(例、3-, 4-, 5-または6-ビリダジニル-N-オキシド)、ペンゾフリル、ベンゾアゾリル、ベンゾオキサゾリル、トリアジニル、オキソ

トリアジニル、テトラゾロ〔1, 5-b〕ピリダジニル、トリアゾロ〔4, 5-b〕ピリダジニル、オキソイミダジニル、ジオキソトリアジニル、ヒロリジニル（例、1-, 2-または3-ピロリジニル）、ピペリジニル（例、1-, 2-, 3-または4-ピペリジニル）、ピラニル（例、2-, 3-または4-ピラニル）、チオピラニル（例、2-, 3-または4-チオピラニル）、オキサジニル（例、1, 4-オキサジニル）、モルホリニル（例、2-, 3-または4-モルホリニル）、チアジニル（例、1, 4-または1, 3-チアジニル）、ビペラジニル（例、1-または2-ビペラジニル）、ペンゾイミダゾリル、キノリル（例、2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-または8-キノリル）、イソキノリル、シンニル、フタラジニル、キナゾリニル、ナフチリジニル（例、1, 8-ナフチリジニル）、アリニル、プテリニジニル、ジベンゾフラン、カルバゾリル、アクリジニル、フェナントリジニル、フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサジニルなどが挙げられる。複素環基の好ましいものとしては、たとえば2-または3-フリル、2-, 3-または4-ピリジル、2-, 4-または5-チアゾリルなどの5または6員複素環基が挙げられる。

【0008】これらの複素環基は、同一または相異なる置換基を1〜5個、好ましくは1個を有してもよく、このような置換基としては例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ヘキシル、イソヘキシルなどのC₁₋₆アルキル基、例えばアリル、イソアリル、イソブチル、2-ペンテンニル、2-ヘキセニルなどのC₂₋₆アルケニル基、例えばプロパルギル、2-ブチニル、3-ブチニル、3-ペンチニル、3-ヘキシニル等のC₂₋₆アルキニル基、例えばフェニル、ナフチル等のC₆₋₁₀アリール基、例えばフェニル-C₁₋₃アルキル（例、ベンジル、フェネチル、フェニルプロピル）などのC₇₋₉アラルキル基、ニトロ基、水酸基、メルカプト基、オキソ基、チオキソ基、シアノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ハロゲン（フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、例えばメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、tert-ブトキシ等のC₁₋₆アルコキシ基、例えばメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ等のC₁₋₄アルキルチオ基、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニルなどのC₁₋₄アルキルスルフィニル基、たとえばフェニルスルフィニルなどのC₆₋₁₀アリールスルフィニル基、メチルスルホニル、エチルスルホニルなどのC₁₋₄アルキルスルホニル基、フェニルスルホニルなどのC₆₋₁₀アリールスルホニル基、アミド基、例えばC₁₋₆アルカノイルアミノ（例、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ）などのC₁₋₆アルシ

ルアミノ、ジエチルアミノ、メチルエチルアミノなどのモノ-又はジ-C₁₋₄アルキルアミノ基、例えば、C₁₋₆アルカノイル（例、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル）、C₆₋₁₄アリール-カルボニル（例、ベンゾイル、ナフタレンカルボニル）、C₁₋₆アルコキシ-カルボニル（例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル）、C₆₋₁₄アリールオキシ-カルボニル（例、フェノキシカルボニル）、C₇₋₁₉アラルキル-カルボニル（例、ベンジルカルボニル、フェネチルカルボニル、フェニルプロピルカルボニルなどのフェニル-C₁₋₄アルキルカルボニル）、C₇₋₁₉アラルキルオキシカルボニル（例、ベンジルオキシカルボニルなどのフェニル-C₁₋₄アルキルオキシカルボニル）などのC₁₋₂₀アシル基、例えば酸素原子、硫黄原子、窒素原子などのヘテロ原子を1〜5個含む3〜6員環またはそのベンゼン環もしくは酸素原子、硫黄原子、窒素原子などのヘテロ原子を1〜5個含む3〜6員環との縮合環系（上記した置換されていてもよい複素環系で置換されたアルキル基の複素環系と同様のものが挙げられる。）などが挙げられる。置換されていてもよい複素環系の好ましい例としては、たとえばハロゲンで1〜2個置換されていてもよいフリル、ピリジルおよびチアゾリル基が挙げられる。置換されていてもよい複素環系で置換されたアルキル基におけるアルキル基としては例えば、メチル、エチル、プロピルなどのC₁₋₃アルキル基などが挙げられる。

【0009】R^{2a}およびR^{3a}で示される炭化水素基の具体例も前記R^{1a}と同様のものがその好適な例として挙げられる。またR^{2a}で示される、R^{3a}と結合する二価の基としてはエチレン、トリメチレンなどのC₁₋₄アルキレン、-CH₂N（Z^{2a}）-CH₂-（Z^{2a}は水素、メチル、エチル、プロピル、n-ブチル、イソブチルなどのC₁₋₆アルキル、アセチル、プロピオニル、ブチリルなどのC₁₋₄アルキル-カルボニルを示す。）で示される基、-CH₂-O-C-CH₂-などが挙げられる。R^{3a}で示される-SR^{4a}（式中、R^{4a}はR^{1a}と同意義を示す。）および-N（R^{5a}）（R^{5a}）（R^{5a}）およびR^{5a}は同一または異なるで、R^{1a}と同意義を示す。）において、R^{4a}、R^{5a}およびR^{5a}は上記R^{1a}で例示した水素原子、炭化水素基、アシル基または置換されていてもよい複素環系で置換されたアルキル基と同様のものが挙げられる。R^{3a}で示される、R^{2a}と結合する二価の基または原子の具体例としては、-S-、メチレン、エチレン等のC₁₋₄アルキレン、-N（Z^{3a}）-（Z^{3a}はZ^{2a}と同意義であり、具体例も同様のものが挙げられる。）で示される基が挙げられる。Y^aで示される式=C（Z^{1a}）-（Z^{1a}は水素原子または炭化水素基を示す。）で表わさ

31

れる基において、Z^{1a}で示される炭化水素基の例としては前記R^{1a}において例示した炭化水素基と同様のものが挙げられ、その炭化水素基の置換基としては、前記R^{1a}の置換されていてもよい複素環基で置換されたアルキル基における複素環基の置換基として挙げられたものと同様のものが挙げられる。該置換基の数は1〜5個、好ましくは1〜3個である。

【0010】X^aで示される電子吸引基としては、例えば、シアノ、ニトロ、たとえばメトキシカルボニル、エトキシカルボニルなどのC₁₋₄アルコキシカルボニル、カルボキシル、例えばフェノキシカルボニルなどのC₆₋₁₆アリールオキシカルボニル、例えばビリジリオキシカルボニル、チエニリオキシカルボニルなどの複素環オキシカルボニル(複素環基としては前記R^{1a}の置換されていてもよい複素環基で置換されたアルキル基における複素環基として挙げられたものと同様のものが挙げられる。)、たとえばメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、エチルスルホニルなどのハロゲン(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1〜3個置換されていてもよいC₁₋₄アルキルスルホニル、スルファモイル、たとえばジエトキシホスホリル等のジ-C₁₋₄アルコキシホスホリル、たとえばアセチル、トリクロロアセチル、トリフルオロアセチル等のハロゲン(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1〜3個置換されていてもよいC₁₋₄アシル(例、ホルミル、アセチルなどのC₁₋₄アルカノイル等)、たとえばベンゾイルなどのC₆₋₁₆アリールカルボニル、カルバモイル、たとえばメチルスルホニルチオカルバモイル等のC₁₋₄アルキルスルホニルチオカルバモイルなどが挙げられる。

【0011】化合物(I)はたとえば塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、硫酸、過塩素酸などの無機酸、たとえば硝酸、酢酸、酒石酸、リンゴ酸、クエン酸、シュウ酸、コハク酸、安息香酸、ピクリン酸、p-トリエンスルホン酸などの有機酸と塩などの農業化学的に許容されうる塩として用いられる。化合物(I)の具体例としては、(i) 1-[N-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-エチルアミノ]-1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン、(ii) 1-(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)-3-メチル-2-ニトログアニジン[N-(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)-N'-メチル-N''-ニトログアニジン]、(iii) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン、(iv) N-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N'-シアノ-N-メチルアセトアミン、(v) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-5-メチル-2-ニトロイミノヘキサヒドロ-1, 3, 5-トリアジン、(vi) 1-(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)-3, 5-ジメチル-2-ニトロイミノヘキサヒドロ-1, 3, 5-トリアジン、(vii) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-3,

32

5-ジメチル-2-ニトロイミノヘキサヒドロ-1, 3, 5-トリアジン、(viii) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-2-ニトロメチレンイミダゾリジン、(ix) 1-[N-(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)-N-エチルアミノ]-1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン、(x) 3-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-2-ニトロメチレンチアゾリジン、(xi) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-2-(1-ニトロ-2-アリルチオエチリデン)イミダゾリジン、(xii) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-2-(1-ニトロ-2-エチルチオエチリデン)イミダゾリジン、(xiii) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-2-(1-ニトロ-2-β-メチルアリルチオエチリデン)イミダゾリジン、(xiv) メチル-[3-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-1-メチル-2-ニトロ]グアニジンホルマート、(xv) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチルアミノ)-1-メチルチオ-2-ニトロエチレン、(xvi) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチルアミノ)-1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン、(xvii) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-3-ニトロ-2-メチルイソチオウレア、(xviii) 3-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-1-メチル-2-ニトログアニジン、(xix) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチルアミノ)-1-ジメチルアミノ-2-ニトロエチレン、(xx) 1-[N-(2-クロロ-5-ビリジルメチル)-N-メチルアミノ]-1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン、(xxi) 1-[N-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-メチルアミノ]-1-ジメチルアミノ-2-ニトロエチレン、(xxii) 3-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-1, 1-ジメチル-2-ニトログアニジン、(xxiii) 1-(6-クロロ-3-ビリジルメチルアミノ)-1-エチルアミノ-2-ニトロエチレン、(xxiv) 1-アミノ-1-[N-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-メチルアミノ]-2-ニトロエチレン、(xxv) 3-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-1, 3-ジメチル-2-ニトログアニジン、(xxvi) 3-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-1, 3-トリメチル-2-ニトログアニジン、(xxvii) 1-アミノ-1-[N-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-エチルアミノ]-2-ニトロエチレン、(xviii) 1-[N-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-n-プロピルアミノ]-1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン、(xxix) 1-[N-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-エチルアミノ]-1-エチルアミノ-2-ニトロエチレン、(xxx) 3-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-3-エチル-1-メチル-2-ニトログアニジン、(xxxi) 1-(3-チエナリドフラニルメチル)-3-メチル-2-ニトログアニジン、(xlii) 3-(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)-5-メチル-4-ニトロイミノ-1, 3, 5-パーヒドロ

オキサジアジン、(xxxiii) 3-(2-クロロ-5-ピリジルメチル)-1, 3-チアゾリジン-2-イリデンシアナミドが挙げられる。なかでも(1) 1-[N-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N'-エチルアミノ]-1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン、(2) 1-(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)-3-メチル-2-ニトログアニジン、(3) 1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロ-イミダゾリジン-2-イリデンアミン、(4) N-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N'-シアノ-N-メチルアセトアミン、(5) 1-(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)-3, 5-ジメチル-2-ニトロ-1, 3, 5-トリアジン、(6) 1-(3-テトラヒドロフランメチル)-3-メチル-2-ニトログアニジン、(7) 3-(2-クロロ-5-チアゾリルメチル)-5-メチル-4-ニトロイミノ-1, 3, 5-トリヒドロオキサジアジン、(8) 3-(2-クロロ-5-ピリジルメチル)-1, 3-チアゾリジン-2-イリデンシアナミドなどが好ましい。このような化合物(1)またはその塩は、特開平3-157308、特開平2-288859、特開平2-288860、特開平61-267575、特開昭60-218386号、特開昭61-178981、特開昭62-81382、特開平2-235881またはWO91/04965公報に記載された方法またはそれに準じた方法で製造することができる。

【0012】上記式(II)で表される化合物またはその塩は、幾何異性体および/または立体異性体が存在する場合があるが、本発明はそれらすべての異性体およびそれらの混合物を包含する。上記式(II)中、Arは置換されていてもよい芳香族炭化水素基または置換されていてもよい芳香族複素環基を示す。Arで示される置換されていてもよい芳香族炭化水素基における芳香族炭化水素基としては、例えば、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントリル等のC₆-11芳香族炭化水素基などが用いられる。該芳香族炭化水素基が有している置換基としては、例えば、(1) ヒドロキシ、アミノ、モノ-もしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ(例、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等)、C₁₋₆アルコキシ(例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等)またはハロゲン原子(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1ないし4個置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、sec-ペンチル、イソペンチル、n-ヘキシル等)、(2) C₁₋₆アルキルもしくはC₁₋₆アルカノイルでモノ-もしくはジ-置換されていてもよいアミノ基(例、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチルアミノ、ブ

ロビオニルアミノ等)、(3) ヒドロキシル基、(4) カルボキシル基、(5) ニトロ基、(6) SF₅、(7) C₁₋₆アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等)、(8) C₁₋₆アルカノイルオキシ基(例、ホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピニルオキシ、n-ブチルオキシ、iso-ブチルオキシ等)、(9) シアノ基および(10) ハロゲン原子(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)などが用いられる。置換の数値は、置換可能な範囲内で1ないし6、好ましくは1ないし4、より好ましくは1ないし3である。また、特に置換基がハロゲン原子である場合は、置換可能な最大範囲まで置換されていてもよい。【0013】Arで示される置換されていてもよい芳香族複素環基における芳香族複素環基としては、例えば、炭素原子以外に例えば酸素原子、硫黄原子、窒素原子などのヘテロ原子を1ないし4個含む5員もしくは8員芳香族複素環基またはその縮合環基(例えば、C₆-10環状炭化水素(例、シクロペンタン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン等)または酸素原子、硫黄原子、窒素原子などのヘテロ原子を1ないし4個含む5員もしくは6員複素環との縮合環基)などが用いられる。具体的には、例えば、炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子、窒素原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む5員芳香族複素環基(例、2-または3-チエニルなどのチエニル、2-または3-フリルなどのフリル、2-、4-または5-オキサゾリルなどのオキサゾリル、2-、4-または5-チアゾリルなどのチアゾリル、3-、4-または5-ピラゾリルなどのピラゾリル、2-、4-または5-イミダゾリルなどのイミダゾリル、3-、4-または5-イソチアゾリルなどのイソチアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリルなどのチアジアゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリルなどのトリアゾリル等)、炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子、窒素原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む6員芳香族複素環基(例、2-、3-または4-ピリジルなどのピリジルもしくはそのN-オキシド、2-、4-または5-ピリミジルなどのピリミジルもしくはそのN-オキシド、3-または4-ピリダジンなどのピリダジンもしくはそのN-オキシド、ピラジニル等)、炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子、窒素原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む2員性または3員性縮合芳香族複素環基(例、ベンゾフリル、ベンゾアゾリル、ベンゾオキサゾリル、テトラゾロ[1, 5-b]ピリダジン、トリアゾロ[4, 5-b]ピリダジン、イミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、ベンゾイミダゾリル、キノリル、イソキノリル、シキノリル、フトラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、インドリジニル、キノリジニル、1, 8-ナフチリジニル、アリニル、アデリジニル、ジノンフラニル、カル

バズリル、アクリジニル、フェナントリジニル、クロマニル、ベンゾオキサジニル、フェナジニル、フェノチアニル、フェノキサジニル等)などが用いられる。該芳香族複素環基が有しているもよい置換基としては、例えば、上記したAで示される芳香族炭化水素基が有しているもよい置換基と同様のものが用いられる。置換の数は、置換可能な範囲内で1ないし6、好ましくは1ないし4で、最も好ましくは1ないし3である。

【0014】R^{1b}で示されるハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。R^{1b}で示される置換されているもよい炭化水素基における炭化水素基としては、例えば、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、アリール基、アラルキル基などが用いられ、なかでもC₁₋₂₀炭化水素基などが好ましい。アルキル基としては、例えば、C₁₋₁₆アルキル基(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプタシル、オクタシル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル等)などが用いられ、なかでも、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、n-ブチル、ペンチル、ヘキシル等のC₁₋₆アルキル基などが好ましい。アルケニル基としては、例えば、C₂₋₁₆アルケニル基(例、ビニル、アリル、2-メチルアリル、2-ブテンニル、3-ブテンニル、3-オクチニル等)などが用いられ、なかでも、ビニル、ブタジエニル、ヘキサトリエニル等のC₂₋₆アルケニル基などが好ましい。アルキニル基としては、例えば、C₂₋₁₀アルキニル基(例、エチニル、2-プロピニル、イソプロピニル、ブチニル、3-ヘキシニル等)などが用いられ、なかでもC₂₋₆アルキニル基などが好ましい。シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル等のC₃₋₆シクロアルキル基などが好ましい。アリール基としては、例えば、フェニル、ナフチル、アントラセニル等のC₆₋₁₄アリール基などが用いられる。アラルキル基としては、例えば、フェニルC₁₋₄アルキル(例、ベンジル、フェニルエチル)、ベンツヒドリル、トリチル等のC₇₋₁₀アラルキル基などが用いられ、なかでもC₇₋₁₀アラルキル基などが好ましい。

【0015】これら炭化水素基の置換基としては例えば、(1)ニトロ基、(2)ドクロキル基、(3)オキソ基、(4)チオキソ基、(5)シアノ基、(6)カルボイル基、(7)カルボキシ基、(8)C₁₋₁₆シル基[例えば、C₁₋₆アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、iso-プロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル等)、C₁₋₆アリールカノイル(例、ホルミル、アセチル、プロピオニル、n-ブチリル、iso-ブチリル等)、C₆₋₁₄アリールカルボニル(例、ベンゾイル等)等]、(9)スルホ基、(10)ハ

ロゲン原子(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、(11)モノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化されているもよいC₁₋₁₄炭化水素オキシ基[例えば、C₁₋₆アルコキシ(例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等)、C₆₋₁₄アリールオキシ(例、フェニル、ナフチルオキシ等)](例えば、o-、m-またはp-クロロフェノキシ、o-、m-またはp-プロモフェノキシ等のモノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化フェニルオキシ等)、(12)-S(O)_nH^{1b}R^{3b}[式中、n^{1b}は0、1または2を、R^{3b}はC₁₋₆アルキル(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル)、C₆₋₁₄アリール(例、フェニル)などのC₁₋₁₄炭化水素基を示す。][例えば、C₁₋₆アルキルチオ(例、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ等)、C₆₋₁₄アリールチオ(例、フェニルチオ等)、C₁₋₆アルキルスルフィニル(例、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、ブチルスルフィニル等)、C₆₋₁₄アリールスルフィニル(例、フェニルスルフィニル)、C₁₋₆アルキルスルホニル(例、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、ブチルスルホニル等)、C₆₋₁₄アリールスルホニル(例、フェニルスルホニル等)、(13)C₁₋₆アルキルもしくはC₁₋₆アルキルカルボニルでモノ-もしくはジ-置換されているもよいアミノ(例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ等)、(14)C₁₋₄アルキルでモノ-もしくはジ-置換されているもよいヒドラゾノ(例えば、メチルヒドラゾノ、エチルヒドラゾノ、ジメチルヒドラゾノ等)および(15)(a)ハロゲン原子(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、(b)C₁₋₄アルキル(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル等)および(c)モノ-、ジ-もしくはトリ-ハロゲン化フェノキシ(例えば、o-、m-またはp-クロロフェノキシ、o-、m-またはp-プロモフェノキシ等)などから選ばれる1ないし4個の置換基を有しているもよい、炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子および窒素原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含むまたは6員複素環基(例えば、2-または3-チエニルなどのチエニル、2-または3-フリルなどのフリル、3-、4-または5-ピラゾリルなどのピラゾリル、2-、4-または5-チアゾリルなどのチアゾリル、3-、4-または5-イソチアゾリルなどのイソチアゾリル、2-、4-または5-オキサゾリルなどのオキサゾリル、3-、4-または5-イソオキサゾリルなどのイソオキサゾリル、2-、4-または5-イミダゾリルなどのイミダゾリル、1、2、3-または1、2、4-トリアゾリルなどのトリアゾリル、1Hまたは2H-テトラゾリルなどのテトラゾリル、2-、3-または4-ピリジリルなどのピリジリル、2

一、4-または5-ビリミジルなどのビリミジル、3-または4-ヒリダジニルなどのヒリダジニル、キノリル、イソキノリル、インドリル等）などが挙げられる。置換の数は、置換可能な範囲内で1ないし5、好ましくは1ないし3である。

【0016】R^{1b}で示される硫黄原子を介する基については後述される。X^{1b}またはY^{1b}で示される炭素原子を介する基としては炭素原子を介して結合するすべての基が該当するが、例えば、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよいアルシル基、シアノ基、置換されていてもよいカルボニル基、アミノ基または置換されていてもよい炭素原子に結合手を有する複素環基などが挙げられる。該置換されていてもよい炭化水素基としては上記R^{1b}における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。

【0017】該置換されていてもよいアルシル基におけるアルシル基としては、C₁₋₂₈脂肪族カルボン酸から誘導されるアルシル基などが用いられる。具体的には、例えば、ホルミル、アセチル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル、tert-ブチルカルボニル等のC₁₋₆アルカノイル基；メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等のC₁₋₆アルコキシカルボニル基；ベンゾイル等のC₆₋₁₄アリールカルボニル基、ベンゾオキシカルボニル等のC₆₋₁₄アリールオキシカルボニル基；フェニル-C₁₋₆アルキルカルボニル（例、ベンジルカルボニル）等のC₇₋₁₆アラールカルボニル基；フェニル-C₁₋₆アルキルオキシカルボニル（例、ベンジロキシカルボニル）等のC₇₋₁₆アラールオキシカルボニル基などが用いられる。このようなアルシル基は上記R^{1b}で例示した置換されていてもよい炭化水素基における炭化水素基の置換基と同様の置換基を有していてもよい。置換の数は、置換可能な範囲内で1ないし5、好ましくは1ないし3である。該置換されていてもよいカルボニル基としては、例えば、置換されていてもよいC₁₋₂₈炭化水素基で置換されていてもよいカルボニル基などが用いられる。該置換されていてもよいC₁₋₂₈炭化水素基としては上記R^{1b}における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。

【0018】該置換されていてもよい炭素原子に結合手を有する複素環基における複素環基としては、炭素原子以外に、窒素原子、酸素原子、硫黄原子などから選ばれた1ないし4個のヘテロ原子を含む1ないし8員環またはその縮合環基（例えば、C₆₋₁₆環状炭化水素（例、シクロペンテン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン等）または酸素原子、硫黄原子、窒素原子などのヘテロ原子を1ないし4個含む1ないし8員複素環と縮合環基）などが用いられる。具体的には、例えば、2-または3-チエニルなどのチエニル、2-または3-フリルなどのフリル、2-または3-ピリニルなどのピリニル、2-、3-または4-ピリジニルなどのピリジニル、

2-、4-または5-オキサピリニルなどのオキサピリニル、2-、4-または5-チアピリニルなどのチアピリニル、3-、4-または5-ピラゾリニルなどのピラゾリニル、2-、4-または5-イミダゾリニルなどのイミダゾリニル、3-、4-または5-イソオキサピリニルなどのイソオキサピリニル、3-、4-または5-イソチアピリニルなどのイソチアピリニル、3-または5-(1,2,4-オキサジニル)、1,3,4-オキサジニルなどのオキサジニル、3-または5-(1,2,4-チアジニル)、1,3,4-チアジニル、4-または5-(1,2,3-チアジニル)、1,2,5-チアジニルなどのチアジニル、1,2,3-トリアゾリニル、1,2,4-トリアゾリニルなどのトリアゾリニル、1H-または2H-テトラゾリニルなどのテトラゾリニル等の炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選ばれたヘテロ原子を1ないし4個含む5員環基；例えば、2-、3-または4-ビリジニルなどのビリジニル、N-オキシド-2-、3-または4-ビリジニルなどのN-オキシドビリジニル、2-、4-または5-ビリミジニルなどのビリミジニル、N-オキシド-2-、4-または5-ビリミジニルなどのN-オキシドビリミジニル、2-または3-オモルホリニルなどのオモルホリニル、2-または3-モルホリニルなどのモルホリニル、トリアジニル、オキソトリアジニル、ジオキソトリアジニルなどの1-2個のオキソを有していてもよいトリアジニル、ヒロジニル、ビベリジニル、ピラニル、チオピラニル、1,4-オキサジニルなどのオキサジニル、1,4-チアジニル、1,3-チアジニルなどのチアジニル、2-または3-ビベラジニルなどのビベラジニル、3-または4-ビリダジニルなどのビリダジニル、ビラジニル、N-オキシド-3-または4-ビリダジニルなどのN-オキシドビリダジニル等の炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子、窒素原子等から選ばれたヘテロ原子を1ないし4個含む6員環基；例えば、ベンゾフリル、ベンゾチアゾリニル、ベンゾオキサゾリニル、テトラゾロ〔1,5-b〕ピリダジニル、トリアゾロ〔4,5-b〕ピリダジニル、イミダゾ〔1,2-a〕ビリジニル、ベンズイミダゾリニル、キノリル、イソキノリル、シンノリル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、インドリジニル、キノリジニル、1,8-ナフチリジニル、アリニル、フエリジニル、ジベンゾフルニル、カルバゾリニル、アクリジニル、フェナントリジニル、クロマニル、ベンゾオキサジニル、フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサジニル等の炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子、窒素原子等から選ばれたヘテロ原子を1ないし4個含む2環性または3環性縮合環基などが用いられる。このように炭素原子に結合手を有する複素環基は上記R^{1b}で例示した置換されていてもよい炭化水素基における炭化水素基の置換基と同様の置換基を有していてもよい。置換の数は、置換可能な範囲内で1ないし5、好ましくは

は1ないし3である。

【0019】 X^{1b} または Y^{1b} で示される窒素原子を介する基としては、窒素原子を介して結合するすべての基が該当する。例えば、①ニトロ基、② $NR^{4b}R^{5b}$ 〔式中、 R^{4b} および R^{5b} はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよいアル基、置換されていてもよいカルバモイル基、置換されていてもよい複素環基、ヒドロキシル基、置換されていてもよい炭化水素オキシ基または $-S(O)_2R^{6b}$ (R^{6b} は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を、 n^{2b} は1または2を示す)で表される基を示す〕で表わされる基、③置換されていてもよい窒素原子に結合手を有する複素環基、または④ $N=C(R^{7b})R^{8b}$ 〔式中、 R^{7b} および R^{8b} はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい炭化水素オキシ基または $NR^{9b}R^{10b}$ (R^{9b} および R^{10b} はそれぞれ水素原子、ヒドロキシル基、置換されていてもよい炭化水素基を示す)で表わされる基を示す〕で表わされる基などが用いられる。

【0020】 R^{4b} 、 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 、 R^{8b} 、 R^{9b} または R^{10b} で示される置換されていてもよい炭化水素基としては、前記 R^{1b} における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが用いられる。 R^{4b} 、 R^{5b} 、 R^{7b} または R^{8b} で示される置換されていてもよい炭化水素オキシ基の置換されていてもよい炭化水素基としては、前記 R^{1b} における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが用いられる。 R^{4b} または R^{5b} で示される置換されていてもよいアル基および置換されていてもよいカルバモイル基としては、前記 X^{1b} または Y^{1b} における置換されていてもよいアル基および置換されていてもよいカルバモイル基と同様のものが用いられる。 R^{6b} または R^{9b} で示される置換されていてもよい複素環基における複素環基としては、前記 X^{1b} または Y^{1b} における置換されていてもよい、炭素原子に結合手を有する複素環基において定義された複素環基と同様のものが用いられる。該複素環基における置換基については後述のものが用いられる。

【0021】上記置換されていてもよい窒素原子に結合手を有する複素環基における複素環基としては、例えば、炭素原子および1個の窒素原子以外に、窒素原子、酸素原子、硫黄原子などから選ばれる1ないし4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3ないし8員環基またはその縮合環基(例えば、 C_{6-10} 環状炭化水素(例、シクロペンタン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン等)または酸素原子、硫黄原子、窒素原子などのヘテロ原子を1ないし4個含むもしくは6員複素環との縮合環基)であって窒素原子に結合手を有する基が用いられる。具体的には、例えば、1H-1-ピロリル、1-イミダゾリル、1-トリアゾリル、1-テトラゾリル、1-インドリル、1H-1-インダゾリル、7-アピリル、

1-アジリジニル、1-ピロリジニル、1-ピロリニル、1-イミダゾリジニル、2-イソキサゾリジニル、1-または4-ピラジニル、3-ピラゾリン-1-イル、3-ピラゾリン-2-イル、1-ピベリジニル、4-モルホリニル、4-チオモルホリニルなどが用いられる。

【0022】 R^{4b} または R^{5b} で示される置換されていてもよい複素環基および上記置換されていてもよい窒素原子に結合手を有する複素環基における複素環基の置換基としては、例えば1)モノ、ジもしくはトリ-ハロゲン化されていてもよい C_{1-20} 炭化水素基〔例、 C_{1-6} アルキル基(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル)、 C_{3-6} アルケニル基(例、ビニル、アリル、2-メチルアリル、2-ブテニル、3-ブテニル)、 C_{2-6} アルキニル基(例、エチン、2-プロピニル、イソプロピニル、ブチニル、4-ブチニル、3-ヘキシニル)、 C_{3-6} シクロアルキル基(例、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル)、 C_{5-7} シクロアルケニル基(例、シクロペンテニル、シクロヘキセニル等)、 C_{7-20} アラルキル基〔例、フェニル- C_{1-4} アルキル(例、ベンジル、フェニルエチル)、ペンツヒドリル、トリチル)、 C_{8-14} アリール基(例、フェニル、ナフチル、アントラセニル)等〕、2) C_{1-14} 炭化水素オキシ基〔例、 C_{1-6} アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ)、 C_{6-14} アリールオキシ基(例、フェノキシ、ナフチルオキシ)等〕、(ここで、ハロゲンとしてはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が例示される。)]、3) C_{1-15} シリル基〔例、 C_{1-6} アルカノイル基(例、ホルミル、アセチル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル、tert-ブチルカルボニル)、 C_{6-14} アリール-カルボニル基(例、ベンゾイル)、 C_{1-6} アルコキシ-カルボニル基(例、アセトキシ、エトキシカルボニル)等〕、4) C_{1-15} シリルオキシ基〔例、 C_{1-6} アルカノイルオキシ基(例、ホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピルオキシ、tert-ブチルオキシ、iso-ブチルオキシ)、 C_{6-14} アリール-カルボニルオキシ基(例、ベンゾイルオキシ)等〕、5)カルボキシ基、6) C_{1-4} アルキルでモノもしくはジ-置換されていてもよいカルバモイル基(例、N-メチルカルバモイル、N-エチルカルバモイル、N-プロピルカルバモイル、N-イソプロピルカルバモイル、N-ブチルカルバモイル、N、N-ジメチルカルバモイル、N、N-ジエチルカルバモイル、N-ジプロピルカルバモイル、N、N-ジブチルカルバモイル等)、7)環状 N コカルボニル基(例、1-アジリニルカルボニル、1-アゼチニルカルボニル、1-ピロリニルカルボニル、1-ピベリニルカルボニル、1-モルホリニルカルボニル、1-メチルピベリニルカルボニル、モルホリニルカルボ

4.1

ニル等)、8)ハロゲン原子(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、9)オキシ基、10)アミノ基、11)C₁₋₆アルキルで置換されているもよい基(例、メチルイミノ、エチルイミノ、プロピルイミノ、ブチルイミノ)、12)C₁₋₆アルキル、カルバモイルもしくはN-モノもしくはN,N-ジ-C₁₋₆アルキルカルバモイルでモノもしくはジ置換されているもよいアミノ基(例、N-メチルカルバモイルアミノ、N-エチルカルバモイルアミノ、N-プロピルカルバモイルアミノ、N-イソプロピルカルバモイルアミノ、N-ブチルカルバモイルアミノ、N,N-ジメチルカルバモイルアミノ、N,N-ジエチルカルバモイルアミノ、N,N-ジプロピルカルバモイルアミノ、N,N-ジブチルカルバモイルアミノ等)、13)炭素原子と1個の窒素原子以外に酸素原子、硫黄原子、窒素原子等から選ばれたヘテロ原子を1ないし3個含んでいるもよい3ないし6員の環状アミノ基(例、アジリジン、アゼチジン、ピロリジン、ピロリニル、ピロリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イミダゾリジン、ヘビリジノ、モルホリノ、ジヒドロピリジン、N-メチルピラジニル、N-エチルピラジニル等)、14)C₁₋₆アルカノイルアミド基(例、ホルムアミド、アセタミド、トリフルオロアセタミド、プロピオニルアミド、ブチルアミド、イソブチルアミド等)、15)ベンツアミド、16)C₁₋₆アルキレンジオキシ基(例、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ等)、17)-B(OH)₂、18)ヒドロキシル基、19)ニトロ基、20)シアノ基、21)-S(O)₂R^{11b}〔式中、R²⁵はO、1または2を、R^{11b}は水素原子またはC₁₋₆炭化水素基を示す。〕〔例えば、メルカプト基、スルホ基、スルフィノ基、C₁₋₆アルキルチオ基(例、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ)、C₆₋₁₄アリールチオ基(例、フェニルチオ)、C₁₋₆アルキルスルフィニル基(例、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、C₆₋₁₄アリールスルフィニル基(例、フェニルスルフィニル)、C₁₋₆アルキルスルホニル基(例、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、ブチルスルホニル)、C₆₋₁₄アリールスルホニル基(例、フェニルスルホニル)等]および22)C₁₋₆アルキルでモノもしくはジ置換されているもよいスルファモイル基(例、N-メチルスルファモイル、N-エチルスルファモイル、N-プロピルスルファモイル、N-イソプロピルスルファモイル、N-ブチルスルファモイル、N,N-ジメチルスルファモイル、N,N-ジエチルスルファモイル、N,N-ジプロピルスルファモイル、N,N-ジブチルスルファモイル等)などが用いられる。置換の数は、置換可能な範囲内で1ないし6、好ましくは1ないし3である。

【0023】X^{1b}またはY^{1b}で示される酸素原子を介す

4.2

る基としては、酸素原子を介して結合するすべての基が該当する。例えば、-OR^{12b}〔R^{12b}は①水素原子、②置換されていてもよい炭化水素基、③置換されていてもよい複素環基、④置換されていてもよいアシル基、⑤置換されていてもよいカルバモイル基、⑥-NR^{13b}R^{14b}〔式中、R^{13b}およびR^{14b}はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示す〕で表わされる基、または⑦-SiR^{15b}R^{16b}〔R^{15b}は置換されていてもよい炭化水素基を示す〕で表わされる基などを用いられる。R^{12b}、R^{13b}、R^{14b}またはR^{15b}で示される置換されていてもよい炭化水素基とは、前記R^{1b}における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが用いられる。R^{12b}、R^{13b}またはR^{14b}で示される置換されていてもよい複素環基としては、前記R^{4b}またはR^{5b}で示される置換されていてもよい複素環基と同様のものが用いられる。R^{12b}で示される置換されていてもよいアシル基および置換されていてもよいカルバモイル基としては、前記X^{1b}またはY^{1b}における置換されていてもよいアシル基および置換されていてもよいカルバモイル基と同様のものが用いられる。

【0024】R^{1b}、X^{1b}またはY^{1b}で示される硫黄原子を介する基としては、硫黄原子を通して結合するすべての基が該当する。例えば、-S(O)_nR^{16b}R^{16b}〔R^{16b}は置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を、n^{16b}は0~2の整数を示す〕で表わされる基などが用いられる。R^{16b}で示される置換されていてもよい炭化水素基としては、前記R^{1b}における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが用いられる。R^{16b}で示される置換されていてもよい複素環基としては、前記R^{4b}またはR^{5b}で示される置換されていてもよい複素環基と同様のものが用いられる。

【0025】X^{1b}またはY^{1b}で示されるリン原子を介する基としては、リン原子を通して結合するすべての基が該当する。例えば、-PO(OR^{17b})₂〔R^{17b}は水素原子またはアルキル基を示す〕で表わされる基などが用いられる。R^{17b}で示されるアルキル基としては、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル等のC₁₋₁₆アルキル基などが用いられる。

【0026】X^{1b}とY^{1b}とが合わさって、式

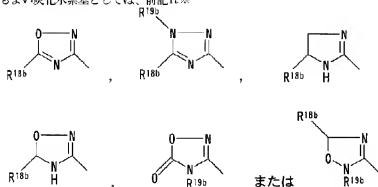
【化25】



で表わされる基が形成する、置換されていてもよい含窒素複素環基の含窒素複素環基としては、1個の窒素原子以外に、窒素原子、酸素原子、硫黄原子またはリン原子などから選ばれる1ないし3個のヘテロ原子を含有していてもよいという18員の含窒素複素環基などが用いられる。該含窒素複素環基の置換基としては置換されてい



〔式中、 R^{18b} は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を、 L^b は酸素原子または C_{1-6} アルキレン基(例、メチレン、エチレン等)を、 Z^b は酸素原子または $-N(R^{19b})-$ (R^{19b} は水素原子または置換されていてもよい炭化水素基を示す)で表わされる基を示す〕で表わされる基などが用いられる。 R^{19b} または R^{19b} で示される置換されていてもよい炭化水素基としては、前記 R^{18b}



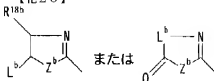
〔式中の記号は前記と同意義を示す〕で表わされる基などが用いられる。 R^{18b} で示されるハロゲン原子としてはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。 R^{18b} で示される炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基としては上記した X^{18b} または Y^{18b} における炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基と同様のものが挙げられる。 W^b で示されるハロゲン原子としてはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。 W^b で示される炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基としては上記した X^{18b} または Y^{18b} における炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基と同様のものが挙げられる。(但し、 W^b の炭素原子を介する基がメチル基である場合、該メチル基は前記した置換されていてもよい炭化水素基における置換基と同様のものに加え、後述する X^{20b} 、 X^{20b} および/または Y^{20b} で置換されていてもよい。)

【0029】上記式(11)において、 A^b は置換されていてもよい芳香族炭化水素基が好ましい。芳香族炭化水素基は、好ましくは、 C_{6-14} 芳香族炭化水素基(例、 $\text{F}^{\star}50$

*でもよい炭化水素基またはオキシ基が好ましい。置換の数は1~3個である。該置換されていてもよい炭化水素基としては前記 R^{18b} と同様の置換されていてもよい炭化水素基が挙げられる。

【0027】具体的には、

【化26】



*における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが用いられる。なかでも、メチル、エチル、プロピルなどの C_{1-6} アルキル基などが好ましい。

【0028】より具体的には、 X^{18b} と Y^{18b} とが合わさって形成する含窒素複素環基としては、

【化27】

★エニル、ナフチル、アントリルなどの C_{6-14} アリール、より好ましくはフェニル基である。置換基としては、例えば、ハロゲン原子(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、 C_{1-6} アルキル基(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル等)、モノー、ジーもしくはトリハロゲン化 C_{1-6} アルキル基(例、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル等)が好ましい。置換基の数は1~5個が好ましい。 A^b としては特に、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル基およびモノー、ジーもしくはトリハロゲン化 C_{1-6} アルキル基から選ばれる1~5個の置換基で置換されたフェニル基などが好適である。 A^b としては、2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル基が最も好ましい。 R^{18b} としては(1)水素原子、(2)シアノ基、(3)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)、(4)カルバモイル基、(5) C_{1-6} アルコキシカルボニル基(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)、(6) C_{1-6} アルキルチオ基(例、メチルチオ、エ

45

チルチオ、*n*-プロピルチオ、イソプロピルチオ等)、
(7) C₁₋₆アルキルスルフィニル基(例、メチルスルフィ
ニル、エチルスルフィニル等)、(8) C₁₋₆アルキルス
ホニル基(例、メチルスルホニル、エチルスルホニ
ル等)、(9)式

【化28】

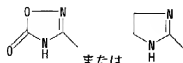
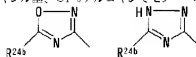


〔式中、各記号は前記と同意義を示す。〕で表わされる
基が好ましい。特に、シアノまたは式

【化29】



(式中、各記号は前記と同意義を示す。)で表わされる
基が好ましい。X^bとしては窒素原子を介する基および
C₁₋₆アルキルチオ基(例、メチルチオ、エチルチオ
等)が好ましい。特に、窒素原子を介する基が好まし
く、中でも-NR^{20b}R^{21b}〔R^{20b}およびR^{21b}はそれぞ
れ水素原子、ヒドロキシ、C₁₋₆アルカノイル(例、ホ
ルミル、アセチル、プロピオニル等)またはC₁₋₆アル
キル(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、
n-ブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル等)を示す。〕で
表わされる基が好ましい。特にX^bはアミノ基、モノー
もしくはジ-メチルアミノ基、アセチルアミノ基、*N*-
ヒドロキシ-*N*-メチルアミノ基などが好ましい。Y^{1b}
としては水素原子または炭素原子、窒素原子もしくは酸
素原子を介する基が好ましい。より具体的には、Y^{1b}は
水素原子；ヒドロキシル基、C₁₋₆アルコキシでモノー*



または

〔R^{24b}は水素原子またはC₁₋₆アルキル基(例、メチ
ル、エチル、プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-
ブチル、*tert*-ブチル等)を示す。〕が好適である。

【0031】式

【化32】

46

*もしくはジ-置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシ基
(例、メトキシ、エトキシ、メトキシメトキシ、ジメト
キシメトキシ等)、ハロゲン原子でモノー、ジ-もしくは
トリ-置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイルオキシ
基(例、ホルミルオキシ、アセチルオキシ、クロロア
セチルオキシ、プロピオニルオキシ等)、モノーもしくは
ジ-C₁₋₆アルキル-カルバモイルオキシ基(例、メ
チルカルバモイルオキシ、エチルカルバモイルオキシ、
ジメチルカルバモイルオキシ等)、C₁₋₆アルコキシ-
カルボニルオキシ基(例、メトキシカルボニルオキシ、
エトキシカルボニルオキシ等)、C₁₋₆アルキルで置換
されていてもよいC₆₋₁₄アリール-カルボニルオキシ基
(例、ベンゾイルオキシ、4-メチルベンゾイルオキシ
シ、4-エチルベンゾイルオキシ、4-*tert*-ブチルベ
ンゾイルオキシ等)などの酸素原子を介する基；式-N
R^{22b}R^{23b}〔式中、R^{22b}およびR^{23b}はそれぞれ水素原
子、C₁₋₆アルキル基(例、メチル、エチル、プロピ
ル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチ
ル等)、C₁₋₆アルカノイル基(例、ホルミル、アセチ
ル、プロピオニル等)またはC₁₋₆アルコキシ-カルボ
ニル基(例メトキシカルボニル、エトキシカルボニル
等)を示す。〕で表わされる基などの窒素原子を介する
基；C₁₋₆アルキル基(例、メチル、エチル、プロピ
ル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチ
ル等)などの炭素原子を介する基などが好ましい。

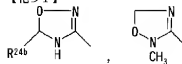
【0030】X^{1b}とY^{1b}とが合わさって、

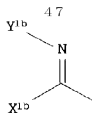
【化30】



が形成する含窒素複素環基としては、具体的には、例え
ば、

【化31】

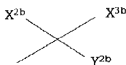




で表される基としては、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イルが最も好ましい。R^{2b}としては窒素原子を介する基及びハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)が好ましい。特に窒素原子を介する基が好ましい。なかでも、-NR^{2bb}R^{2bb}(式中、R^{2bb}およびR^{2bb}はそれぞれ(1)水素原子、(2)C₁₋₆アルキル(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)、(3)ベンゾイルで1個置換されていてもよいC₇₋₂₀アラルキル(例、ベンジルなどのフェニル-C₁₋₄アルキル)、(4)モノもしくはジ-C₁₋₈アルキル-カルバモイル基(例、メチルカルバモイル、ジメチルカルバモイル、エチルカルバモイル等)、(5)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1〜3個置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイル(例、ホルミル、アセチル、プロピオニル、n-ブチル、イソブチル等)、(6)C₈₋₁₄アリールカルボニル(例、ベンゾイル)または(7)C₁₋₆アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)を示す。)で表わされる基または-N=C(R^{27b})R^{28b}(式中、R^{27b}およびR^{28b}はそれぞれ(1)水素原子、(2)C₁₋₆アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)および(3)C₁₋₆アルコキシ(例、メトキシ、エトキシ等)および/またはヒドロキシで1〜3個置換されていてもよいC₈₋₁₄アリール基(例、フェニル基)；(4)C₁₋₆アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ等)；(5)モノもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基(例、メチルアミノ、ジメチルアミノ、エチルアミノ、ジエチルアミノ等)または(6)ヒドロキシアミノ基を示す。)で表わされる基などが好ましい。

【0032】W^bとしては(1)硫黄原子を介する基、(2)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)もしくはC₁₋₆アルキルチオ(例、メチルチオ、エチルチオ等)で1〜15個置換されていてもよいC₁₋₆アルカノイル基(例、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチル、イソブチル、ペンタノイル、ヘキサノイル等)、または(3)式

【化33】



(式中、X^{2b}は置換されていてもよいハロアルキル基を、X^{3b}は水素原子または炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を、Y^{2b}は窒

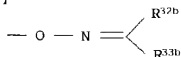
素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基を示すか、あるいはX^{2b}とY^{2b}とでチオキソ基、ヒドロキシミノ基またはオキシラン環を形成してもよく、R^{2b}とY^{2b}とで、置換されていてもよい、酸素原子、窒素原子、硫黄原子もしくはリン原子から選ばれる少なくとも一つのヘテロ原子で構成炭素原子が置換されたC₂₋₄アルキレン基またはC₂₋₄アルケニレン基を形成してもよい)で表わされる基が好ましい。

【0033】X^{2b}の置換されていてもよいハロアルキル基におけるハロアルキルとしては、例えばハロC₁₋₆アルキル(例、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ヘptaフルオロプロピル、ノナフルオロプロピル、トリデカフルオロヘキシル等)が挙げられる。該ハロアルキル基が有していてもよい置換基としては、上記R^{1b}における置換されていてもよい炭化水素基における置換基と同様のものが挙げられる。置換の数は、置換可能な数の範囲内で1ないし4、好ましくは1ないし3である。X^{2b}としては特に上記したハロC₁₋₆アルキル基(ハロゲンで置換されたC₁₋₆アルキル基)が好ましい。X^{3b}で示される炭素原子を介する基としては上記X^{1b}またはY^{1b}における炭素原子を介する基と同様のものが挙げられる。X^{3b}またはY^{2b}で示される窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基としては、上記X^{1b}またはY^{1b}における窒素原子、酸素原子、硫黄原子もしくはリン原子を介する基と同様のものが挙げられる。

【0034】X^{3b}としては水素原子または炭素原子を介する基が好ましく、特に、(1)水素原子、または(2)(i)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、(ii)ヒドロキシ、(iii)C₁₋₆アルキルチオ(例、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ等)、(iv)C₁₋₆アルコキシ(例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ等)、(v)-NR^{29b}R^{30b}(R^{29b}およびR^{30b}はそれぞれ水素原子、C₁₋₆アルキル(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル等)、C₁₋₆アルカノイルアミノ(例、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ等)またはC₇₋₂₀アラルキル(例、ベンジル、フェニルなどのフェニル-C₁₋₄アルキル等)を示す。)、(vi)-PO(OR^{31b})₂(R^{31b}はC₁₋₆アルキル(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル等)を示す。)もしくは(vii)酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む5〜6員複素環基(例、1-ビペリジニル、4-モルホリニル等)から選ばれる置換基で1〜3個置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基(例、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル等)が好ましい。

【0035】 Y^{25} としては、(i)ヒドロキシル基、(2) (i) C_{1-6} アルコキシ(例、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ等)、(ii) C_{1-6} アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)または(ii)モノもしくはジ- C_{1-6} アルキルアミノ(例、メチルアミノ、ジメチルアミノ、エチルアミノ、ジエチルアミノ等)で1〜3個置換されているもよい C_{1-6} アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ等)、(3) C_{2-10} アリールカルボニルオキシ基(例、ビニルオキシ、アリールオキシ、2-メチルアリールオキシ等)、(4) C_{8-14} シクロアルキルオキシ基(例、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ等)、(5) C_{1-6} アルキル(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)または C_{6-14} アリール(例、フェニル)で1〜2個置換されているもよいカルバモイルオキシ基、(6)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1〜3個置換されているもよい C_{1-6} アルカノイルオキシ基(例、ホルミルオキシ、アセチルオキシ等)、(7)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)または C_{1-6} アルキル(例、メチル、エチル等)で1〜3個置換されているもよい C_{8-14} アリールオキシ基(例、フェニルオキシ等)、(8) C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ基(例、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ)、(9) (i) C_{1-6} アルキル(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル等)、(ii) シアノ、(ii) ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、または(iv)モノ、ジもしくはトリ-ハロゲン C_{1-6} アルキル(例、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル等)で1〜3個置換されているもよい C_{8-14} アリールカルボニルオキシ基(例、ベンゾイルオキシ等)、(10)ニトロで1または2個置換されているもよい C_{6-14} アリールオキシカルボニルオキシ基(例、フェニルカルボニルオキシ等)、(11) C_{1-6} アルコキシカルボニルアミノオキシ基(例、メトキシカルボニルアミノオキシ、エトキシカルボニルアミノオキシ等)、(12)ベンゾイルで置換されているもよい C_{7-20} アラールキルオキシ基(例、ベンジルオキシなどのフェニル- C_{1-4} アルキルオキシ等)、(13)式

【化34】

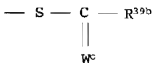


[式中、 R^{32b} および R^{33b} はそれぞれ(i)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1〜3個置換されているもよい C_{8-14} アリール基(例、フェニル)または(ii) C_{1-6} アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)を示す。]で表わされる基、(14)式-OSi(R^{35b})₃[式中 R^{35b} は C_{1-6} アルキル

基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)を示す。]で表わされる基、(15) (i) C_{1-6} アルキル(例、メチル、エチル等)、(ii) C_{1-6} アルキルチオ(例、メチルチオ、エチルチオ等)および(iii)オキソから選ばれる置換基で1〜3個置換されているもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1〜4個有する5〜6員複素環とベンゼン環との縮合環基(例、ピリミジン、ピロリジン、イソインドリニル等)、(16) (i) C_{1-6} アルキル(例、メチル、エチル等)、(ii) アセチルアミノ、(iii) オキソ、(iv) ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)および(v) ヒドロキシから選ばれる置換基で1〜3個置換されているもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1〜4個有する5〜6員複素環またはそのベンゼン環もしくは酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1〜4個有する5〜6員複素環との縮合環基(例、イソキサゾリジン、バーヒドロアゾシニル、アジリジン、モルホリニル、ペビリジン、ピロリジン、イソインドリニル、トリアゾリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル等)、(17) 式-N R^{35b} R 36b [式中、 R^{35b} および R^{36b} はそれぞれ(i)水素原子、(ii)ヒドロキシル基、(iii)シアノ、ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、 C_{1-6} アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)またはモノもしくはジ- C_{1-6} アルキルアミノ(例、メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等)で1〜3個置換されているもよい C_{1-6} アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)、(iv) ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)または C_{1-6} アルキル(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)で1〜3個置換されているもよい C_{6-14} アリール基(例、フェニル)、(v) ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1〜3個置換されているもよい C_{1-6} アルコキシカルボニル基(例、メトキシカルボニル等)、(vi) C_{1-6} アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ等)、(vii) C_{7-20} アラールキルオキシ基(例、ベンジルオキシなどのフェニル- C_{1-4} アルキルオキシ等)、(viii) C_{1-6} アルコキシカルボニル基(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)、(ix)モノもしくはジ- C_{1-6} アルキルカルバモイル基(例、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、ジメチルカルバモイル等)、(x) C_{2-10} アルキル基(例、エチニル、2-プロピニル、イソプロピニル、ブチニル等)、(xi) ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1〜3個置換されているもよい C_{6-14} アリールスルホニル基(例、フェニルスルホニル等)、(xii) ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1〜3個置

51

換されていてもよいC₁₋₈アルキルスルホニル基(例、メチルスルホニル、エチルスルホニル等)、(xiii)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されていてもよいC₁₋₈アルキルスルフィニル基(例、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル等)、(xiv)C₁₋₈アルキル(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)で1~3個置換されていてもよいC₈₋₁₄アリールスルホニルアミノ基(例、フェニルスルホニルアミノ等)、(xv)C₁₋₈アルカノイルアミノ基(例、ホルミルアミノ、アセチルアミノ等)または(xv i)C₁₋₈アルコキシカルボニルアミノ基(例、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ等)を示す。)で表わされる基、(18)式-N=C(R^{37b}R^{38b})(式中、R^{37b}およびR^{38b}はそれぞれ水素原子、C₁₋₈アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)、C₁₋₆アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ等)またはC₈₋₁₄アリール基(例、フェニル)を示す。)で表わされる基、(19)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)またはC₁₋₈アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)で1~3個置換されていてもよいC₁₋₈アルキルチオ基(例、メチルチオ、エチルチオ等)、(20)C₆₋₁₄アリールチオ基(例、フェニルチオ等)、(21)式



(式中、W⁰はOまたはSを、R^{39b}は式-NR^{40b}R^{41b}(R^{40b}およびR^{41b}はそれぞれC₁₋₈アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)を示す。)で表わされる基、C₁₋₈アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)またはC₁₋₈アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ等)を示す。)で表わされる基、(22)C₈₋₁₄アリールスルホニル基(例、フェニルスルホニル等)、(23)C₁₋₈アルキルスルホニル基(例、メチルスルホニル、エチルスルホニル等)、(24)C₁₋₈アルキルスルフィニル基(例、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル等)、(25)(i)シアノ、(ii)C₁₋₈アルコキシカルボニル(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)および(iii)(a)ハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されていてもよいC₈₋₁₄アリール(例、フェニル等)および/または(b)C₁₋₈アルキル(例、メチル、エチル、n-プロピル、

52

イソプロピル等)で1~2個置換されていてもよいカルバモイル基から選ばれる1~3個の置換基で置換されていてもよいC₁₋₈アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)、または(26)式-P(O)(R^{42b})₂(式中、R^{42b}はC₁₋₈アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ等)を示す。)で表わされる基が好ましい。

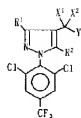
【0036】R^{2b}とY^{2b}とで形成する、置換されていてよい、酸素原子、窒素原子、硫黄原子もしくはリン原子から選ばれる少なくとも一つのヘテロ原子で構成炭素原子が置換されたC₂₋₆アルキレン基またはC₂₋₆アルケニレン基の好ましい例としては、式-Z^{2b}-CR^{43b}R^{44b}-NR^{45b}-(式中、R^{43b}、R^{44b}およびR^{45b}は水素または置換されていてもよい炭化水素基を、Z^{2b}は酸素原子または-NR^{46b}-(R^{46b}は水素または置換されていてもよい炭化水素基を示す。))で表わされる基を示す。)で表わされる基;式-Z^{2b}-C(R^{47b})=N-(式中、R^{47b}は水素、置換されていてもよい炭化水素基またはアミノ基を、Z^{2b}は前記と同意義を示す。))で表わされる基;式-N=CR^{43b}-NR^{44b}-(式中、R^{43b}およびR^{44b}は前記と同意義を示す。))で表わされる基;または式Z^{2b}-C(W⁰)-NR^{44b}-(式中、R^{44b}およびZ^{2b}は前記と同意義を、W⁰は酸素原子または硫黄原子を示す。)で表わされる基である。

【0037】上記R^{43b}、R^{44b}、R^{45b}、R^{46b}およびR^{47b}で表わされる置換されていてもよい炭化水素基は前記R^{1b}における置換されていてもよい炭化水素基と同様のものが挙げられる。特にC₁₋₈アルキル(例、メチル、エチル等)が好ましい。W⁰における硫黄原子を介する基としては式-S(O)_n-R^{48b}(式中、n^{5b}は0~2の整数を、R^{48b}はハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~3個置換されていてもよいC₁₋₈アルキル基(例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル等)を示す。)で表わされる基が好ましい。

【0038】化合物(II)としては、特開昭63-316771号公報に記載の5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-α, α'-トリフルオロ-p-トリル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルヒザゾール-3-カルボニトリルに加え、特開平8-311036および特開平9-15036に記載された化合物、すなわち、以下に示す表1~36に示される化合物またはその塩が好ましく用いられる。

【0039】

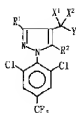
【表1】



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-1	CN	NH ₂	CF ₃	H	OH	132-134
1-2	CN	NH ₂	CF ₃	H	OMe	165-167
1-3	CN	NH ₂	CF ₃	H	OE _t	160-162
1-4	CN	NH ₂	CF ₃	H	OPr ⁱ	91-92
1-5	CN	NH ₂	CF ₃	H		157.5-158
1-6	CN	NH ₂	CF ₃	H		170-170.5
1-7	CN	NH ₂	CF ₃	H		135-137
1-8	CN	NH ₂	CF ₃	H	OCH ₂ CO ₂ E _t	138-140
1-9	CN	NH ₂	CF ₃	H		131.5-132.5
1-10	CN	NH ₂	CF ₃	H		186-188
1-11	CN	NH ₂	CF ₃	H		206-208
1-12	CN	NH ₂	CF ₃	H		197-201

【0040】

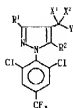
40【表2】



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-13	CN	NH ₂	CF ₃	H	$\begin{array}{c} \text{Me} \\ \\ \text{OC}-\text{OMe} \\ \\ \text{Me} \end{array}$	167-169
1-14	CN	NH ₂	CF ₃	H	OAc	157-158
1-15	CN	NH ₂	CF ₃	H	OPh	138-141
1-16	CN	NH ₂	CF ₃	H	$\begin{array}{c} \text{OCOE}t \\ \\ \text{O} \end{array}$	151-153
1-17	CN	NH ₂	CF ₃	H	$\begin{array}{c} \text{OCPh} \\ \\ \text{O} \end{array}$	196-196.5
1-18	CN	NH ₂	CF ₃	H	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$	185-186.5
1-19	CN	NH ₂	CF ₃	H	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Me}$	178.5-180
1-20	CN	NH ₂	CF ₃	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCNHP}r^i \end{array}$	206-208
1-21	CN	NH ₂	CF ₃	H	$\begin{array}{c} \text{Me} \\ \\ \text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_3-\text{N} \\ \\ \text{SMe} \end{array}$	102-(dec.)
1-22	CN	NH ₂	CF ₃	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{O}-\text{N} \\ \\ \text{O} \end{array}$	213-215

【0041】

* * 【表3】

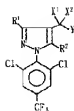


化合物 No.	R¹	R²	X¹	X²	Y	mp. (°C)
1-23	CN	NH₂	CF₃	H		(74.4/75.2)¹¹
1-24	CN	NH₂	CF₃	H		203-206
1-25	CN	NH₂	CF₃	H		160-162
1-26	CN	NH₂	CF₃	H		156-158
1-27	CN	NH₂	CF₃	H		154-156
1-28	CN	NH₂	CF₃	H		156-159
1-29	CN	NH₂	CF₃	H		228-230
1-30	CN	NH₂	CF₃	H		202-204
1-31	CN	NH₂	CF₃	H		126-125
1-32	CN	NH₂	CF₃	H		180-182

1) NMR(CDCl₃, δ) 8.24(d, 2H, J=10Hz), 7.80(s, 1H), 7.75(s, 1H),
5.66(q, 1H, J=6Hz), 4.25(s, 2H)

【0042】

* * 【表4】



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-33	CN	NH ₂	CF ₃	H	$O-N \begin{matrix} \nearrow Me \\ \searrow Me \end{matrix}$	157-159
1-34	CN	NHMe	CF ₃	H	OH	130-132
1-35	CN	NHMe	CF ₃	H	OAc	169-171
1-36	CN	NHMe	CF ₃	H	OMe	136-138
1-37	CN		CF ₃	H	OH	(油状物) ²⁾
1-38	CN		CF ₃	H	OH	175-177
1-39	CN	NHAc	CF ₃	H	OAc	(油状物) ³⁾
1-40	CN	NHCHO	CF ₃	H	OH	192-194
1-41	CN		CF ₃	H	OH	176-180
1-42	CN	N=CHNMe ₂	CF ₃	H	OH	(油状物) ⁴⁾

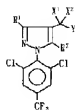
2) NMR(CDCl₃, δ) 8.52(s, 1H), 7.78-7.71(m, 2H), 7.22-7.19(m, 2H),
6.94(d, 1H, J=9Hz), 6.26(s, 1H), 5.27-5.13(m, 1H), 4.23(br, 1H),
3.86(s, 3H)




3) NMR(CDCl₃, δ) 7.82(br, 1H), 7.76(s, 2H), 6.30(q, 1H, J=7Hz),
2.26(s, 3H), 2.03(s, 3H)

4) NMR(CDCl₃, δ) 7.79(s, 1H), 7.72(s, 1H), 7.70(s, 1H),
5.10(5重線, 1H, J=6Hz), 4.42(d, 1H, J=6Hz), 2.98(s, 3H), 2.80(s, 3H)

【0043】

* * 【表5】



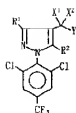
化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-43	CN	N=OMe	CF ₃	H	OCH(OMe) ₂	80-81
1-44	CN	NHMe	CF ₃	H	OPr ¹	165-166
1-45	CN	NH ₂	CF ₃	H	NH ₂	171-173
1-46	CN	NH ₂	CF ₃	H	NHMe	140-142
1-47	CN	NH ₂	CF ₃	H	NMe ₂	187-189
1-48	CN	NH ₂	CF ₃	H	NHPh	160-162
1-49	CN	NH ₂	CF ₃	H	NEAc	257-260
1-50	CN	NH ₂	CF ₃	H	NH- 	176-177.5
1-51	CN	NH ₂	CF ₃	H	NH- 	150-152
1-52	CN	NH ₂	CF ₃	H	N- 	187-188.5
1-53	CN	NH ₂	CF ₃	H	NHOMe	157-158
1-54	CN	NH ₂	CF ₃	H	NHOH	(74%77%) ⁵⁾
1-55	CN	NH ₂	CF ₃	H	NHOCH ₂ Ph	164-166
1-56	CN	NH ₂	CF ₃	H	N-OMe Me	159-160

5) NMR(CDCl₃, δ) 7.79(s, 2H), 5.25(br, 1H), 4.70(q, 1H, J=7Hz),

4.38(br, 2H)

[0044]

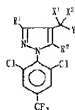
* * 【表6】



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-57	CN	NH ₂	CF ₃	H	N OMc Et	149-150
1-58	CN	NH ₂	CF ₃	H	N OPr ¹ Me	124-125
1-59	CN	NH ₂	CF ₃	H	N OEt Me	139-140
1-60	CN	NH ₂	CF ₃	H	N OCH ₂ Ph Me	172-174
1-61	CN	NH ₂	CF ₃	H	N OEt Et	132-134
1-62	CN	NH ₂	CF ₃	H	N-OH Me	181-183
1-63	CN	NH ₂	CF ₃	H		214-215
1-64	CN	NH ₂	CF ₃	H		197-198
1-65	CN	NH ₂	CF ₃	H		105-107

【0045】

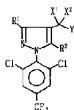
* * 【表7】



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-66	CN	NH ₂	CF ₃	H		196-198
1-67	CN	NH ₂	CF ₃	H		243-246
1-68	CN	NH ₂	CF ₃	H		242-244
1-69	CN	NH ₂	CF ₃	H		196-199
1-70	CN	NH ₂	CF ₃	H		212-214
1-71	CN	NH ₂	CF ₃	H		163-165
1-72	CN	NH ₂	CF ₃	H		163-165
1-73	CN	NH ₂	CF ₃	H		112-113.5
1-74	CN	NH ₂	CF ₃	H		163-166
1-75	CN	NH ₂	CF ₃	H		200-201
1-76	CN	NH ₂	CF ₃	H		191-193
1-77	CN	NH ₂	CF ₃	H		166.5-168
1-78	CN	NH ₂	CF ₃	H		224-226

【0046】

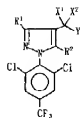
* * 【表8】






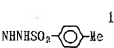





化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-79	CN	NH ₂	CF ₃	H	N-Ac Me	223-225
1-80	CN	NH ₂	CF ₃	H		254-255
1-81	CN	NH ₂	CF ₃	H		160-160.5
1-82	CN	NH ₂	CF ₃	H		124-127
1-83	CN	NH ₂	CF ₃	H	NHSO ₂ -	240.5-241
1-84	CN	NH ₂	CF ₃	H	NHSO ₂ Me	230-231
1-85	CN	NH ₂	CF ₃	H		88.5-90
1-86	CN	NH ₂	CF ₃	H		187.5-188.5
1-87	CN	NH ₂	CF ₃	H		105-110
1-88	CN	NH ₂	CF ₃	H		167-169
1-89	CN	NH ₂	CF ₃	H		184-187

【0047】

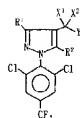
* * 【表9】



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-90	CN	NH ₂	CF ₃	H		188-200
1-91	CN	NH ₂	CF ₃	H		214-215.5
1-92	CN	NH ₂	CF ₃	H		193-194
1-93	CN	NH ₂	CF ₃	H		193-195
1-94	CN	NH ₂	CF ₃	H		135-136
1-95	CN	NH ₂	CF ₃	H		196-198
1-96	CN	NH ₂	CF ₃	H		236-237
1-97	CN	NH ₂	CF ₃	H		227-229
1-98	CN	NH ₂	CF ₃	H		208-211

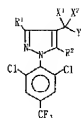
【0048】

* * 【表10】



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-99	CN	NH ₂	CF ₃	H	ONHCOEt O	163-165
1-100	CN	NH ₂	CF ₃	H	N=Ph	228-230
1-101	CN	NHCOCF ₃	CF ₃	H	NHCOCF ₃	(77-77.2) ⁶⁾
1-102	CN	NHCOCF ₃	CF ₃	H	N COCF ₃ Me	292-295
1-103	CN	NMe ₂	CF ₃	H	NHSO ₂ CF ₃	204-206
1-104	CN	NEMe	CF ₃	H	NMe ₂	140-141
1-105	CN	N=Me OMe	CF ₃	H	N=Me OMe	115-119
1-106	CN	NH ₂	CF ₃	H	SMe	156-158
1-107	CN	NH ₂	CF ₃	H	SPh	157-159
1-108	CN	NH ₂	CF ₃	H	SCF ₃	142-144
1-109	CN	NH ₂	CF ₃	H	SCNHc ₂ S	158-159
1-110	CN	NH ₂	CF ₃	H	SCMe O	150-153
1-111	CN	NH ₂	CF ₃	H	SO ₂ Ph	198-199

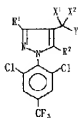
6) NMR(DMSO, δ) 12.59(d, 1H, J=8Hz), 8.16(s, 2H), 5.70(5重線, 1H, J=8Hz)



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-112	CN	NH ₂	CF ₃	H	SO ₂ Me	217-221
1-113	CN	NH ₂	CF ₃	H	SOMe	199-202
1-114	CN	NH ₂	CF ₃	H	SCH ₂ CO ₂ Et	(71.7-71.8) ⁷⁾
1-115	CN	NH ₂	C ₂ F ₅	H	OH	74-76
1-116	CN	NH ₂	C ₂ F ₅	H	OMe	148-152
1-117	CN	NH ₂	C ₂ F ₅	H	OCNHMe O	209-211
1-118	CN	NH ₂	CF ₂ Cl	H	OH	100-105
1-119	CN	NH ₂	CF ₂ Cl	H	OMe	143
1-120	CN	NH ₂	CF ₂ Cl	H	OCNHMe O	203-205
1-121	CN	NH ₂	CF ₂ Cl	H	OAc	164-165
1-122	CN	NH ₂	CF ₂ Cl	H	OCCH ₂ Cl O	168
1-123	CN	NHMe	CF ₂ Cl	H	OMe	119-120
1-124	CN	NHMe	CF ₂ CF ₂ H	H	OH	116-119
1-125	CN	NH ₂	CF ₂ CF ₂ H	H	OMe	136-139
1-126	CN	NH ₂	CF ₂ CF ₂ H	H	OAc	147-149

7) NMR(CDC1₃, δ) 7.80(s, 2H), 4.94(q, 1H, J=7Hz), 4.20-4.31(m, 4H),

3.23, 3.43(q_{AB}, 2H, J_{AB}=45Hz), 1.33(t, 3H, J=7Hz)



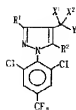
化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-127	CN	NH ₂	CF ₂ CF ₂ H	H	OCNHMe O	186-188
1-128	CN	NMe ₂	CF ₂ CF ₂ H	H	OMe	141-143
1-129	CN	NH ₂	C ₃ F ₇	H	OH	156-158
1-130	CN	NEt ₂	C ₃ F ₇	H	OAc	115-116.5
1-131	CN	NH ₂	C ₄ F ₉	H	OH	(77.7°C) ⁸⁾
1-132	CN	NH ₂	C ₄ F ₉	H	OAc	135-136
1-133	CN	NH ₂	C ₄ F ₉	H	OCNHMe O	165-167
1-134	CN	NH ₂	C ₄ F ₉	H	OMe	146-147
1-135	CN	NHMe	C ₄ F ₉	H	OMe	139-142
1-136	CN	NH ₂	C ₆ F ₁₃	H	OH	115-116
1-137	CN	NH ₂	C ₆ F ₁₃	H	OAc	(77.7°C) ⁹⁾
1-138	CN	NH ₂	C ₂ F ₅	H	NMe ₂	133-136
1-139	CN	NH ₂	CF ₃	H	—CN —CN	229-232

8) NMR(CDCl₃, δ) 7.80(s, 2H), 5.40(cd, 1H, J=8Hz, 16Hz), 4.29(br, 2H), 3.41(br, 1H)

9) NMR(CDCl₃, δ) 7.80(s, 2H), 6.37(q, 1H, J=7Hz), 4.08(br, 2H), 2.23(s, 3H)

【0051】

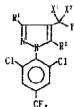
* * 【表13】



化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-140	CN	NH ₂	CF ₃	H		184.5-185
1-141	CN	NH ₂	CF ₃	H		149-154
1-142	CN	NH ₂	CF ₃	H		167-168
1-143	CN	NH ₂	CF ₃	H		153-155
1-144	CN	NH ₂	CF ₃	H		200-202
1-145	CN	NH ₂	CF ₃	H		149-151
1-146	CN	NH ₂	CF ₃	H		200-201
1-147	CN	NH ₂	CF ₃	Me	OH	215-217
1-148	CN	NH ₂	CF ₃	Me	OMe	160-161
1-149	CN	NH ₂	CF ₃	Me		177-178
1-150	CN	NH ₂	CF ₃	Me	OEt	149-150
1-151	CN	NH ₂	CF ₃	Me	OAc	177-178

【0052】

* * 【表14】



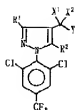
化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-152	CN	NH ₂	CF ₃	Me	$\begin{array}{c} \text{OCPh} \\ \\ \text{O} \end{array}$	172-173
1-153	CN	NHMe	CF ₃	Me	OMe	133-134
1-154	CN	NHEt	CF ₃	Me	OMe	124-125
1-155	CN	NHEt	CF ₃	Me	OEt	87-89
1-156	CN	NEt ₂	CF ₃	Me	OMe	136-137
1-157	CN	NHPr ¹	CF ₃	Me	OMe	131.5-132.5
1-158	CN	NMe ₂	CF ₃	Me	OMe	129.5-130.5
1-159	CN	$\begin{array}{c} \text{NHCH}_2\text{C}_6\text{H}_4\text{OPh} \end{array}$	CF ₃	Me	OH	(75/77.5) ¹⁶⁾
1-160	CN	$\begin{array}{c} \text{NHCH}_2\text{C}_6\text{H}_4\text{OPh} \end{array}$	CF ₃	Me	$\begin{array}{c} \text{OCu}_2\text{C}_6\text{H}_4\text{OPh} \end{array}$	145-147
1-161	CN	$\begin{array}{c} \text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CONHMe} \\ \diagdown \text{CONHMe} \end{array} \end{array}$	CF ₃	Me	OCONEtMe	197-198
1-162	CN	NH ₂	CF ₃	CF ₃	OH	208-209
1-163	CN	NH ₂	CF ₃	CF ₃	OMe	185.5-186.5
1-164	CN	NH ₂	CF ₃	CF ₃	$\begin{array}{c} \text{OCNHNMe} \\ \\ \text{O} \end{array}$	227-228
1-165	CN	NHMe	CF ₃	CF ₃	OH	230-231

10) NMR(CDCl₃, δ) 7.59(m, 2H), 6.60-7.50(m, 9H), 5.33(br, 1H),

3.70-4.05(m, 2H), 3.01(br, 1H), 1.99(s, 3H)

{0053}

* * [表15]



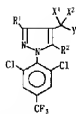
化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-166	CN	NHMe	CF ₃	CF ₃	OMe	145-146
1-167	CN	NMe ₂	CF ₃	CF ₃	OMe	103-105
1-168	CN	NHCNHMe O	CF ₃	CF ₃	OH	201.5-202.5
1-169	O COH	NH ₂	CF ₃	CF ₃	OH	180.5-182
1-170	CN	NH ₂	CF ₃	Et	OH	189-191
1-171	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ Br	OH	178-179
1-172	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ Br	OMe	177-178
1-173	NH MeS	NH ₂	CF ₃	H	OH	(74-77.5) ¹¹⁾
1-174	Me	NH ₂	CF ₃	H	OH	217
1-175	CF ₃	NH ₂	CF ₃	H	OH	169-170
1-176	CN	NH ₂	C ₂ F ₅	H	OAc	170-172
1-177	CN	NH ₂	CF ₃	H	SCOEt S	107-110
1-178	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ SMe	OH	138-140
1-179	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ N(Me) ₂	OH	151.5-154.5
1-180	CN	NHAC	CF ₃	CH ₂ OMe	OH	170-172
1-181	CF ₃	NH ₂	CF ₃	Me	OH	179.5-180.5
1-182	CF ₃	NH ₂	CF ₃	H	OCNMe S	164-165
1-183	CF ₃	NHMe	CF ₃	Me	OMe	91-93
1-184	CN	NH ₂	C ₂ F ₅	H	OAc	170-172

11) NMR(CDCl₃, δ) 9.49(br, 1H), 9.08(d, 1H, J=5Hz), 7.77(s, 2H)

4.88(m, 1H), 3.58(br, 2H), 2.36(s, 3H)

【0054】

* * 【表16】

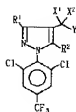


化合物 No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	Y	mp. (°C)
1-185	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ N ₂ O	OH	181.5-185
1-186	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ N ₂ O	OH	195-196
1-187	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ P(OEt) ₂	OH	188-191
1-188	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ OH	OMe	97-99
1-189	CN	NH ₂	CF ₃	H		212-214
1-190	CN	Br	CF ₃	H	OH	141.5-143.5
1-191	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ NHMe	OH	187-190
1-192	H ₂ NCO	NH ₂	CF ₃	Me	OH	155-156
1-193		NH ₂	CF ₃	H	OH	182-183.5
1-194	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ NEt ₂	OH	128.5-132
1-195	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ NMe ₂	OMe	70-75
1-196	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ NHAc	OH	229-231
1-197	CN	NH ₂	CF ₃	CH ₂ NHCH ₂ Ph	OH	149-151
1-198		NH ₂	CF ₃	Me	OH	128-129
1-199	MeS	NH ₂	CF ₃	H	OH	147-148
1-200	MeS	NHAc	CF ₃	H	OH	181-183
1-201	MeS	NH ₂	CF ₃	Me	OH	131.5-132.5
1-202	MeS	NH ₂	CF ₃	H		(74.7-75.2) ^{1,2)}

12) NMR(CDCl₃, δ) 7.74(m, 2H), 6.19(q, 1H, J=7.4Hz), 4.95-5.12(m, 1H)
3.92(br, 2H), 2.82(d, 3H, J=4.8Hz), 2.49(s, 3H)

【0055】

* * 【表17】

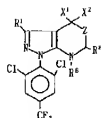


化合物 No.	R¹	R²	X¹	X²	Y	mp. (°C)
1-203	MeSO	NH₂	CF₃	H	OH	171-173 (ジステレオマー-A)
1-204	MeSO	NH₂	CF₃	H	OH	153-154 (ジステレオマー-B)
1-205	MeSO	NH₂	CF₃	Me	OH	200-202 (ジステレオマー-A)
1-206	MeSO	NH₂	CF₃	Me	OH	193-194 (ジステレオマー-B)
1-207	MeSO₂	NH₂	CF₃	Me	OH	186-187
1-208	MeSO₂	NH₂	CF₃	Me	OMe	181-182
1-209	MeS	NH₂	CF₃	Me	OMe	106-108
1-210	MeSO₂	NH₂	CF₃	H	OH	113-114
1-211		Br	CF₃	H	OH	166-167
1-212	"	NH₂	CF₃	H	OH	(75%77%) ¹³⁾
1-213		NH₂	CF₃	H	OH	210-212
1-214		NH₂	CF₃	H	OH	122-125
1-215	"	NH₂	CF₃	Me	OH	177-178
1-216		NH₂	CF₃	H	OH	79- 82
1-217		NH₂	CF₃	H	OH	112-115

13) NMR(CDCl₃, δ) 7.77(s, 2H), 5.21(br, 2H), 4.85(q, 1H, J=8Hz),
3.73(br, 2H), 6.80-3.20(br, 3H)

【0056】

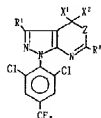
* * 【表18】



化合物 No.	R¹	R⁵	R⁶	X¹	X²	Z	mp. (°C)
2- 1	CN	H	H	CF₃	H	O	165-167
2- 2	CN	H	Me	CF₃	H	O	200-203
2- 3	CN	H	Et	CF₃	H	O	167-169
2- 4	CN	H	Pr¹	CF₃	H	O	134-136
2- 5	CN	H	CF₃	CF₃	H	O	174-178
2- 6	CN	Me	Pr¹	CF₃	H	O	126-135
2- 7	CN	H	Pr¹	C₂F₆	H	O	147-151
2- 8	CN	H	Me	CF₃	Me	O	232-235
2- 9	CN	H	Et	CF₃	Me	O	187-189
2-10	CN	H	Pr¹	CF₃	Me	O	161-163
2-11	CN	H	Me	CF₃	Me	O	232-235
2-12	CN	H	H	CF₃	H	NMe	203-205
2-13	CN	H	Pr¹	CF₃	H	NH	149-151
2-14	CN	H	Pr¹	CF₃	H	NMe	152-155
2-15	CN	Me	Pr¹	CF₃	H	NMe	173-176
2-16	CN	H	H	CF₃	H	NH	154-158
2-17	CN	H	Me	CF₃	H	NH	229-232
2-18	CN	H	Me	CF₃	H	NMe	175.5-176.5

【0057】

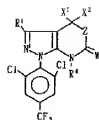
* * 【表19】



化合物 No.	R¹	R⁵	X¹	X²	Z	mp. (°C)
3- 1	CN	H	CF₃	H	NMe	170-173
3- 2	CN	NH₂	CF₃	H	NH	264-267
3- 3	CN	Me	CF₃	H	O	148-150
3- 4	CN	H	CF₃	H	NH	201-204

【0058】

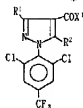
* * 【表20】



化合物 No.	R¹	R⁶	X¹	X²	Z	W	mp. (°C)
4-1	CN	H	CF₃	H	NH	O	>300
4-2	CN	H	CF₃	H	NH	S	270-273

【0059】

* * 【表21】



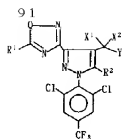
化合物 No.	R¹	R²	X¹	mp. (°C)
5-1	CN	NH₂	CF₃	227-230
5-2	CN	NH₂	C₂F₅	194-196
5-3	CN	NH₂	C₃F₇	192.5-194.5
5-4	CN	NH₂	C₄F₉	146.5-148
5-5	CN	NH₂	CF₂CF₂H	211-213
5-6	CN	NH₂	C₆F₁₃	156-157
5-7	CN	NH₂	CF₂Cl	229-230
5-8	CN	NH₂	CF₂SMe	162-165
5-9	CN	NHCOCF₃	CF₃	(油状物) ¹⁴⁾
5-10	CN	NHCOC₂F₅	C₂F₅	260-262
5-11	H	NH₂	CF₃	(74.7-75.7) ¹⁵⁾
5-12	CF₃	NH₂	CF₃	116-117

14) NMR(CDCl₃, δ) 8.27(br, 1H), 8.18(s, 2H)

15) NMR(CDCl₃, δ) 7.92(s, 1H), 7.79(s, 2H), 6.14(br, 2H)

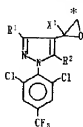
【0060】

※ ※ 【表22】



化合物 No.	Q	R¹	R²	X¹	X²	Y	mp. (°C)
6-1	NAc	Me	NH₂	CF₃	H	OAc	196-198
6-2	NH	H	N=CHOMe	CF₃	H	OH	179-181
6-3	O	H	N=CHOMe	CF₃	H	OH	166-169

【0061】

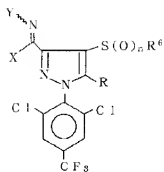


* 【表23】

化合物 No.	R¹	R²	X¹	mp. (°C)
7-1	CN	NH₂	CF₃	173-174.5
7-2	CO₂Me	NH₂	CF₃	244-246

【0062】

※ ※ 【表24】

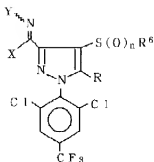




Comp. No.	R ⁶	R	X	Y	n	mp. (°C)
8-1	Me	NH ₂	NH ₂	OH	0	201-203
8-2	Me	NH ₂	NH ₂	OH	2	132-134
8-3	Me	NH ₂	NH ₂	OMe	2	194-196
8-4	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OH	1	203-205
8-5	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NH ₂	1	
8-6	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NHMe	1	
8-7	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NMe ₂	1	
8-8	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NHCOMe	1	
8-9	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NMeCOMe	1	
8-10	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NHCO ₂ Et	1	
8-11	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OMe	1	175-177
8-12	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OCOMe	1	(74.77s) ¹⁾
8-13	CF ₃	NH ₂	NHCOMe	OMe	1	
8-14	CF ₃	NHCOMe	NHCOMe	OMe	1	
8-15	CF ₃	NH ₂	NHMe	OMe	1	
8-16	CF ₃	NHMe	NHMe	OMe	1	

1) NMR(DMSO, δ) 2.13(3H, s), 6.74(4H, br), 8.20(2H, s)

【0063】

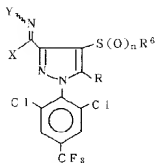
* * 【表25】



Comp. No.	R ⁶	R	X	Y	n	mp. (°C)
8-17	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NH ₂	2	
8-18	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NHMe	2	
8-19	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NMe ₂	2	
8-20	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NHCOMe	2	
8-21	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NMeCOMe	2	
8-22	CF ₃	NH ₂	NH ₂	NHCO ₂ Et	2	
8-23	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OMe	2	
8-24	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OCOMe	2	
8-25	CF ₃	NH ₂	NHCOMe	OMe	2	
8-26	CF ₃	NHCOMe	NHCOMe	OMe	2	
8-27	CF ₃	NH ₂	NHMe	OMe	2	
8-28	CF ₃	NHMe	NHMe	OMe	2	
8-29	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OH	2	205-206
8-30	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OH	0	185-187
8-31	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OCO ₂ Me	1	(746/773) ²⁾
8-32	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OCO-  -Bu ¹	1	(746/773) ³⁾
8-33	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OCO- 	1	137-141
8-34	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OCH(OMe) ₂	1	175-177
8-35	CF ₃	NH ₂	NH ₂	Me	1	221-223
8-36	CF ₃	NH ₂	NMe ₂	H	1	123-126
8-37	CF ₃	NH ₂	N(OH)Me	H	1	187-191

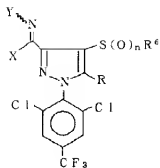
2) NMR(DMSO, δ) 3.79(3H, s), 6.73(4H, br), 8.20(2H, s)

3) NMR(DMSO, δ) 1.33(9H, s), 6.74(2H, br), 6.91(2H, br),
7.52(2H, d, J=8.4Hz), 8.14(2H, d, J=8.4Hz),
8.19(2H, s)



Comp. No.	R ^a	R	X	Y	n	mp. (°C)
8-38	CF ₃	NHMe	NH ₂	OH	0	
8-39	CF ₃	NMe ₂	NH ₂	OH	0	210-212
8-40	CF ₃	NHEt	NH ₂	OH	0	187-189
8-41	CF ₃	NEt ₂	NH ₂	OH	0	195-196
8-42	CF ₃	NHPr ⁱⁱ	NH ₂	OH	0	
8-43	CF ₃	NPr ⁱⁱ ₂	NH ₂	OH	0	
8-44	CF ₃	NHPr ⁱ	NH ₂	OH	0	
8-45	CF ₃	NHCH ₂ Ph	NH ₂	OH	0	
8-46	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	NH ₂	OH	0	
8-47	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OH	1	
8-48	CF ₃	NHMe	NH ₂	OH	1	
8-49	CF ₃	NMe ₂	NH ₂	OH	1	158-160
8-50	CF ₃	NHEt	NH ₂	OH	1	185-187
8-51	CF ₃	NEt ₂	NH ₂	OH	1	175-177
8-52	CF ₃	NHPr ⁱⁱ	NH ₂	OH	1	
8-53	CF ₃	NPr ⁱⁱ ₂	NH ₂	OH	1	
8-54	CF ₃	NHPr ⁱ	NH ₂	OH	1	199-200
8-55	CF ₃	NHCH ₂ Ph	NH ₂	OH	1	(766/773) ⁽¹¹⁾
8-56	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	NH ₂	OH	1	160-161
8-57	CF ₃	NH ₂	NH ₂	OH	2	
8-58	CF ₃	NHMe	NH ₂	OH	2	205-206
8-59	CF ₃	NMe ₂	NH ₂	OH	2	94-96
8-60	CF ₃	NHEt	NH ₂	OH	2	181-182

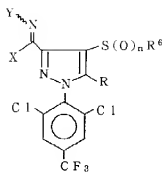
11) NMR(CDCl₃, δ) 4.04(2H, d, J=4.5Hz), 5.00(2H, brs), 6.87-7.08 (3H, m), 7.12-7.37(4H, m), 7.42-7.58(2H, m)



Comp. No.	R ⁶	R	X	Y	n	mp. (°C)
8-61	CF ₃	NEt ₂	NH ₂	OH	2	89-91
8-62	CF ₃	NHPr ⁿ	NH ₂	OH	2	
8-63	CF ₃	NPr ⁿ ₂	NH ₂	OH	2	
8-64	CF ₃	NHPr ⁱ	NH ₂	OH	2	
8-65	CF ₃	NHCH ₂ Ph	NH ₂	OH	2	
8-66	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	NH ₂	OH	2	
8-67	CF ₃	NH ₂	N(OH)Me	H	0	155-166
8-68	CF ₃	NHMe	N(OH)Me	H	0	
8-69	CF ₃	NMe ₂	N(OH)Me	H	0	190-192
8-70	CF ₃	NHEt	N(OH)Me	H	0	127-128
8-71	CF ₃	NEt ₂	N(OH)Me	H	0	177-178
8-72	CF ₃	NHPr ⁿ	N(OH)Me	H	0	
8-73	CF ₃	NPr ⁿ ₂	N(OH)Me	H	0	
8-74	CF ₃	NHPr ⁱ	N(OH)Me	H	0	
8-75	CF ₃	NHCH ₂ Ph	N(OH)Me	H	0	
8-76	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	N(OH)Me	H	0	
8-77	CF ₃	NHMe	N(OH)Me	H	1	
8-78	CF ₃	NMe ₂	N(OH)Me	H	1	156-162
8-79	CF ₃	NHEt	N(OH)Me	H	1	220-227
8-80	CF ₃	NEt ₂	N(OH)Me	H	1	178-181
8-81	CF ₃	NHPr ⁿ	N(OH)Me	H	1	
8-82	CF ₃	NPr ⁿ ₂	N(OH)Me	H	1	
8-83	CF ₃	NHPr ⁱ	N(OH)Me	H	1	154-156

【0066】

* * 【表28】

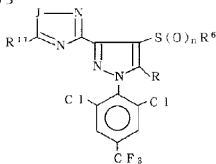


Comp. No.	R ⁶	R	X	Y	n	mp. (°C)
8-84	CF ₃	NHCH ₂ Ph	N(OH)Me	H	1	
8-85	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	N(OH)Me	H	1	81-84
8-86	CF ₃	NH ₂	N(OH)Me	H	2	181-183
8-87	CF ₃	NHMe	N(OH)Me	II	2	
8-88	CF ₃	NMe ₂	N(OH)Me	H	2	
8-89	CF ₃	NHEt	N(OH)Me	H	2	96-97
8-90	CF ₃	NEt ₂	N(OH)Me	H	2	166-167
8-91	CF ₃	NHPr ⁿ	N(OH)Me	II	2	
8-92	CF ₃	NPr ⁿ ₂	N(OH)Me	H	2	
8-93	CF ₃	NHPr ⁱ	N(OH)Me	II	2	
8-94	CF ₃	NHCH ₂ Ph	N(OH)Me	II	2	
8-95	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	N(OH)Me	H	2	
8-96	CF ₃	NH ₂	NH ₂	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OCNHEt} \end{array}$	1	211-215
8-97	CF ₃	NH ₂	NH ₂	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OCCH}_2\text{Cl} \end{array}$	1	196-197
8-98	CF ₃	NH ₂	NH ₂	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OCNMe}_2 \end{array}$	1	(75/77/78) ⁴⁾
8-99	CF ₃	NHCONHEt	NH ₂	OH	1	196-198
8-100	CF ₃	NHCOPh	NH ₂	OH	2	152-154
8-101	CF ₃	NHCOPh	NH ₂	OH	1	219-221

4) NMR(DMSO, δ) 2.98(6H, s), 5.20(2H, br), 5.43(2H, br), 7.80(2H, s)

【0067】

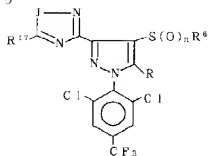
* * 【表29】



Comp. No.	R ⁶	R	J	R ¹⁷	n	mp. (°C)
9-1	Me	N=CH~OMe	O	H	0	119-121
9-2	CF ₃	NH ₂	O	H	1	200-202
9-3	CF ₃	NH ₂	O	Me	1	221-223
9-4	CF ₃	NH ₂	NH	H	1	232-234
9-5	CF ₃	NH ₂	NH	Me	1	
9-6	CF ₃	NH ₂	NMe	Me	1	
9-7	CF ₃	NH ₂	O	H	2	205-208
9-8	CF ₃	NH ₂	O	Me	2	
9-9	CF ₃	NH ₂	NH	H	2	
9-10	CF ₃	NH ₂	NH	Me	2	
9-11	CF ₃	NH ₂	NMe	Me	2	
9-12	CF ₃	NH ₂	O	H	0	190-192
9-13	CF ₃	N=CH~NHOH	O	H	0	171-174
9-14	CF ₃	N=CH~NHOH	O	H	1	112-114
9-15	CF ₃	N=CH~OMe	O	H	1	137-139
9-16	CF ₃	N=CH~OMe	O	H	2	157.5-158.5
9-17	CF ₃	N=CH~OMe	O	H	0	119-121
9-18	CF ₃	N=CH~NHMe	O	H	1	220-221
9-19	CF ₃	N=CH~NMe ₂	O	H	1	140-140.5
9-20	CF ₃	NECHO	O	H	0	147-149
9-21	CF ₃	NECHO	O	H	1	182-184

【0068】

* * 【表30】



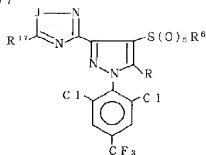
Comp. No.	R ⁶	R	J	R ¹⁷	n	mp. (°C)
9-22	CF ₃	NHMe	O	H	0	
9-23	CF ₃	NMe ₂	O	H	0	95.5-97
9-24	CF ₃	NHEt	O	H	0	119-120
9-25	CF ₃	NEt ₂	O	H	0	94-95
9-26	CF ₃	NHPr ⁿ	O	H	0	
9-27	CF ₃	NPr ⁿ ₂	O	H	0	
9-28	CF ₃	NHPr ⁱ	O	H	0	
9-29	CF ₃	NHCH ₂ Ph	O	H	0	
9-30	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	O	H	0	
9-31	CF ₃	NHMe	O	H	1	
9-32	CF ₃	NMe ₂	O	H	1	82-84
9-33	CF ₃	NHEt	O	H	1	142.5-144
9-34	CF ₃	NEt ₂	O	H	1	117-119
9-35	CF ₃	NHPr ⁿ	O	H	1	
9-36	CF ₃	NPr ⁿ ₂	O	H	1	
9-37	CF ₃	NHPr ⁱ	O	H	1	133-134
9-38	CF ₃	NHCH ₂ Ph	O	H	1	
9-39	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	O	H	1	126-127
9-40	CF ₃	NHMe	O	H	2	156.5-157.5
9-41	CF ₃	NMe ₂	O	H	2	140-142
9-42	CF ₃	NHEt	O	H	2	188-189
9-43	CF ₃	NEt ₂	O	H	2	177-179
9-44	CF ₃	NHPr ⁿ	O	H	2	
9-45	CF ₃	NPr ⁿ ₂	O	H	2	



【0069】

* * 【表31】

107

108

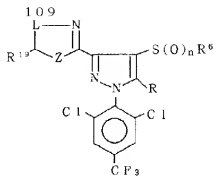


Comp. No.	R ⁶	R	J	R ¹⁷	n	mp. (°C)
9-46	CF ₃	NHPr ¹	O	H	2	
9-47	CF ₃	NHCH ₂ Ph	O	H	2	
9-48	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	O	H	2	
9-49	CF ₃	NHAc	O	H	2	163-164
9-50	CF ₃	NHAc	O	H	1	171-173
9-51	CF ₃	NHCO ₂ Me	O	H	2	170-171
9-52	CF ₃	N=CH-OEt	O	H	1	88-90
9-53	CF ₃	N=CH-OEt	O	H	2	104-105
9-54	CF ₃	NHCO ₂ Me	O	H	1	145-147
9-55	CF ₃	N=CH-OEt	O	H	1	108-109
9-56	CF ₃	N=CH- 	O	H	0	(74-77°C) ⁵⁾
9-57	CF ₃	NHCONHEt	O	H	1	166-168
9-58	CF ₃	NHCOPh	O	H	2	202-204
9-59	CF ₃	N=CH-OEt	O	H	0	90-91.5
9-60	CF ₃	NHAc	O	H	0	(74-77°C) ⁸⁾
9-61	CF ₃	NHCOPh	O	H	1	199-202
9-62	CF ₃	N=CH- 	O	H	1	(74-77°C) ⁷⁾

- 5) NMR(CDCl₃, δ) 3.89(3H, s), 6.17(1H, s), 6.98(1H, d, J=7.9Hz), 7.30-7.37(2H, m), 7.74(2H, s), 8.88(1H, s), 8.96(1H, s)
- 6) NMR(CDCl₃, δ) 2.13(3H, s), 7.30(1H, br), 7.75(2H, s), 8.88(1H, s)
- 7) NMR(CDCl₃, δ) 3.82(3H, s), 6.36(1H, br), 6.94(1H, d, J=8.2Hz), 7.22(1H, d, J=1.8Hz), 7.34(1H, dd, J=1.8Hz, 8.2Hz), 7.73-7.75(1H, m), 7.78-7.80(1H, m)

【0070】

* * 【表32】



Comp. No.	R ⁶	R ¹⁹	R	Z	L	n	mp. (°C)
10-1	CF ₃	H	NH ₂	NH	CH ₂	1	(75-77.5) ⁸⁾
10-2	CF ₃	H	NH ₂	NH	CH ₂ CH ₂	1	
10-3	CF ₃	H	NH ₂	NH	CH ₂	2	
10-4	CF ₃	H	NH ₂	NH	CH ₂ CH ₂	2	
10-5	CF ₃	H	NH ₂	NH	O	1	126-130
10-6	CF ₃	Me	NH ₂	NH	O	1	(75-77.5) ⁹⁾
10-7	CF ₃	Et	NH ₂	NH	O	1	(75-77.5) ¹⁰⁾
10-8	CF ₃	H	NH ₂	NH	O	0	182-184
10-9	CF ₃	H	NMe	NH	O	0	
10-10	CF ₃	H	NMe ₂	NH	O	0	
10-11	CF ₃	H	NMe ₂	NH	O	0	
10-12	CF ₃	H	NEt ₂	NH	O	0	
10-13	CF ₃	H	NHPr ^a	NH	O	0	
10-14	CF ₃	H	NPr ^a ₂	NH	O	0	
10-15	CF ₃	H	NHPr ¹	NH	O	0	
10-16	CF ₃	H	NHCH ₂ Ph	NH	O	0	
10-17	CF ₃	H	N(CH ₂ Ph) ₂	NH	O	0	

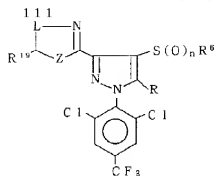
8) NMR(DMSO, δ) 3.75(4H, br), 5.22(3H, br), 7.80(2H, s)

9) NMR(DMSO, δ) 1.52 and 1.54(3H, d+d, J=5.1Hz), 5.00(1H, br), 5.18
ジステレオマー混合物 (2H, br), 5.83(quint, J=5.1Hz, 1H), 7.81(s, 2H)

10) NMR(DMSO, δ) 0.95-1.05(3H, m), 1.72-1.83(2H, m), 5.0(1H, br),
ジステレオマー混合物 5.22(2H, br), 5.64(1H, q, J=5.0Hz), 7.81(2H, s)

【0071】

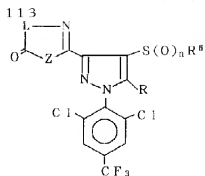
* * 【表33】



Comp. No.	R ⁶	R ¹⁹	R	Z	L	n	mp. (°C)
10-18	CF ₃	H	NHMe	NH	O	1	
10-19	CF ₃	H	NMe ₂	NH	O	1	
10-20	CF ₃	H	NHEt	NH	O	1	
10-21	CF ₃	H	NEt ₂	NH	O	1	
10-22	CF ₃	H	NHPr ⁿ	NH	O	1	
10-23	CF ₃	H	NPr ⁿ ₂	NH	O	1	
10-24	CF ₃	H	NHPr ⁱ	NH	O	1	
10-25	CF ₃	H	NHCH ₂ Ph	NH	O	1	
10-26	CF ₃	H	N(CH ₂ Ph) ₂	NH	O	1	
10-27	CF ₃	H	NH ₂	NH	O	2	202-204
10-28	CF ₃	H	NHMe	NH	O	2	
10-29	CF ₃	H	NMe ₂	NH	O	2	
10-30	CF ₃	H	NHEt	NH	O	2	
10-31	CF ₃	H	NEt ₂	NH	O	2	
10-32	CF ₃	H	NHPr ⁿ	NH	O	2	
10-33	CF ₃	H	NPr ⁿ ₂	NH	O	2	
10-34	CF ₃	H	NHPr ⁱ	NH	O	2	
10-35	CF ₃	H	NHCH ₂ Ph	NH	O	2	
10-36	CF ₃	H	N(CH ₂ Ph) ₂	NH	O	2	
10-37	CF ₃	H	N=CH-OMe	NH	O	1	201-204

【0072】

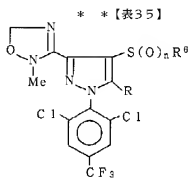
* * 【表34】



Comp. No.	R ⁸	R	Z	L	n	mp. (°C)
11- 1	CF ₃	NH ₂	NH	O	1	270-273(dec.) ^{1,2)}

12) NMR(DMSO, δ) 7.06(2H, br), 8.22(2H, s), 13.22(1H, br)

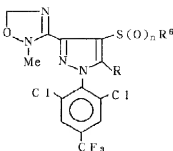
【0073】



Comp. No.	R ⁸	R	n	mp. (°C)
12- 1	CF ₃	NH ₂	0	
12- 2	CF ₃	NHMe	0	
12- 3	CF ₃	NMe ₂	0	
12- 4	CF ₃	NHEt	0	
12- 5	CF ₃	NEt ₂	0	
12- 6	CF ₃	NHPr ⁿ	0	
12- 7	CF ₃	NPr ⁿ ₂	0	
12- 8	CF ₃	NHPr ¹	0	

【0074】

* * 【表36】



Comp. No.	R ⁶	R	n	mp. (°C)
12-9	CF ₃	NHCH ₂ Ph	0	
12-10	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	0	
12-11	CF ₃	NH ₂	1	165-167
12-12	CF ₃	NHMe	1	
12-13	CF ₃	NMe ₂	1	
12-14	CF ₃	NHt	1	
12-15	CF ₃	NEt ₂	1	
12-16	CF ₃	NHPr ⁿ	1	
12-17	CF ₃	NPr ⁿ ₂	1	
12-18	CF ₃	NHPr ⁱ	1	
12-19	CF ₃	NHCH ₂ Ph	1	
12-20	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	1	
12-21	CF ₃	NH ₂	2	
12-22	CF ₃	NHMe	2	
12-23	CF ₃	NMe ₂	2	
12-24	CF ₃	NHt	2	
12-25	CF ₃	NEt ₂	2	
12-26	CF ₃	NHPr ⁿ	2	
12-27	CF ₃	NPr ⁿ ₂	2	
12-28	CF ₃	NHPr ⁱ	2	
12-29	CF ₃	NHCH ₂ Ph	2	
12-30	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	2	

【0075】上記した化合物(II)の中で特に好ましい化合物は5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ- α , α , α -トリフルオロ-p-トリル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール-3-カルボニトリル、5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(N-ヒドロキシ-N-メチルアミノ)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メトキシメチレンジアミノ-3-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-*50

*4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール、5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール、5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンジアミノ-3-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-*50

117

イル) -4-トリフルオロメチルスルフィニルビラゾール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルスルフィニル)-5-ジメチルアミノ-3-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルビラゾールである。

【0076】このような化合物【I】またはその塩は、特開昭63-316771、特開平8-311036、特開平9-15036に記載の方法またはそれらに準じた方法で製造することができる。

【0077】本発明の化合物【II】の塩としては、農薬化学上許容可能な塩が挙げられる。すなわち、分子内にカルボキシル基、スルホ基などの酸性基を有している場合、塩基との塩を形成させてよく、この塩基としては例えばナトリウム、カリウム、リチウム等のアルカリ金属、カルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類金属、アンモニウムなどの無機塩基、例えばピリジン、コリン、トリエチルアミン、トリエタノールアミンなどの有機塩基などが用いられる。また、例えば塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、硫酸、過塩素酸等の無機酸の塩または、例えば乳酸、酢酸、酒石酸、リンゴ酸、クエン酸、シュウ酸、コハク酸、安息香酸、ピクリン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸の塩などが用いられる。また化合物【II】は分子内塩を形成する場合もあり、その場合も本発明の方法に用い得る。

【0078】式【II】で表される化合物に包含される化合物の別の態様として式【III】で表される化合物またはその塩も好ましく用いられる。上記式【III】で表される化合物またはその塩は、幾何異性体および/または立体異性体が存在する場合があるが、本発明はそれらすべての異性体を包含する。R^{1a}で示されるC₁₋₆アルキル基としては、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチルなどが挙げられる。R^{1c}で示されるC₁₋₈ハロアルキル基としては、例えば、クロロメチル、フルオロメチル、ブロモメチル、2-クロロエチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロプロピル、ノナフルオロブチルなどのハロゲン(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)で1~10個(好ましくは1~5個)置換されたC₁₋₆アルキル基が用いられる。R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}およびR^{2e}におけるC₁₋₆アルキル基としては、前記R^{1a}で例示したC₁₋₆アルキル基と同様のものが挙げられる。R^{2a}およびR^{2b}はそれぞれ水素原子が好ましい。

【0079】R^{5a}で示される置換されていてもよいアルキルのアルキル基としては、前記R^{1a}で例示したC₁₋₆アルキル基が挙げられる。該アルキル基の置換基としては、ヒドロキシル基、アミノ基、モノもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基(例、メチルアミノ、エチル

118

アミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等)、C₁₋₆アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ等)、C₁₋₄アルキルチオ基(例、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ等)、ハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、カルボキシル基、ニトロ基、シアノ基などが挙げられる。置換の数は、置換可能な範囲内でないし6、好ましくは1ないし3である。R^{5a}で示される置換されていてもよいアルキルのアルキル基としては、カルボン酸から誘導される炭素数1から20のアルキル基が挙げられ、例えば、ホルミル、アルカンノイル基、好ましくは炭素数2から10のアルカンノイル基(例、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、ビバロイル等のC₁₋₈アルキルカルボニル基)、シクロアルカンノイル基、好ましくは炭素数4から10のシクロアルカンノイル基(例、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等)、アルケニルカルボニル基、好ましくは炭素数3から10のアルケニルカルボニル基(例、アクリロイル、アリルカルボニル、イソプロベニルカルボニル、イソブチニルカルボニル、1-メチルアリルカルボニル、シナモイル等)、アルキニルカルボニル基、好ましくは炭素数3から7のアルキニルカルボニル基(例、プロパルギルカルボニル、2-ブチニルカルボニル、3-ブチニルカルボニル、3-ペンチニルカルボニル等)、アリールカルボニル基、好ましくは炭素数6から14のアリールカルボニル基(例、ベンゾイル、1-ナフトイル、2-ナフトイル等)、アルコキシカルボニル基、好ましくは炭素数1から6のアルコキシカルボニル基(例、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル等)、アリールオキシカルボニル基、好ましくは炭素数6から14のアリールオキシカルボニル基(例、フェノキシカルボニル基)、アラールキルカルボニル基、好ましくは炭素数7から19のアラールキルカルボニル基(例、ベンジルカルボニル、フェニルカルボニル、フェニルプロピルカルボニルなどのフェニル-C₁₋₄アルキルカルボニル、ベンズヒドロキルカルボニル、1-ナフトールカルボニルなどのナフトール-C₁₋₄アルキルカルボニル等)、アラールキルオキシカルボニル基、好ましくは炭素数7から19のアラールキルオキシカルボニル基(例、ベンジルオキシカルボニル、フェニルオキシカルボニル、フェニルプロピルオキシカルボニルなどのフェニル-C₁₋₄アルキルオキシカルボニル)、カルバモイル基、環状アミノカルボニル基(例、1-ピロリジノカルボニル、ピペリジノカルボニル、モルホリノカルボニル等)などが用いられる。

119

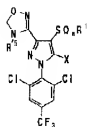
【0080】該アシル基がアルカノイル基、シクロアルカノイル基、アルケニルカルボニル基、アルキニルカルボニル基、アリールカルボニル基、アルコキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アラールカルボニル基、アラールオキシカルボニル基の場合、置換基として1〜6個（好ましくは1〜3個）のヒドロキシ基、アミノ基、モノーもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基（例、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等）、C₁₋₆アルコキシ基（例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ等）、C₁₋₆アルキルチオ基（例、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ等）、ハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、カルボキシル基、ニトロ基、シアノ基、フェニル基などを有していてもよい。該アシル基がカルバモイル基の場合、置換基として1もしくは2個のC₁₋₆アルキル基（例、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル等）、C₃₋₉シクロアルキル基（例、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等）、C₂₋₈アルケニル基（例、ビニル、アリル、1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル等）、C₂₋₉アルキニル基（例、エチニル、1-プロピニル、プロパルギル、1-ブチニル等）、ヒドロキシ基、C₁₋₆アルコキシ基（例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ等）、アミノ基、モノーもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基（例、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等）、環状アミノ基（例、1-ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノ、4-メチル-1-ピペラジノ等）またはフェニル基を有していてもよく、また、該置換基は結合する窒素原子とともに環状アミノ基（例、1-ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノ、4-メチル-1-ピペラジノ等）を形成してもよい。さらに該置換基はヒドロキシ基、ア

120

ミノ基、モノーもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基（例、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等）、C₁₋₆アルコキシ基（例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ等）、C₁₋₆アルキルチオ基（例、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ等）、ハロゲン原子（例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、フェニル基、カルボキシル基、ニトロ基およびシアノ基から選ばれる1〜6（好ましくは1〜3）個の置換基で置換されていてもよい。R⁵⁰としては上記した中でも置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルカノイル基、置換されていてもよいシクロアルカノイル基、置換されていてもよいアルケニルカルボニル基、置換されていてもよいアリールカルボニル基、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基、置換されていてもよいカルバモイル基が好ましい。特に、(1) C₁₋₆アルコキシで1〜3個置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、(2) C₁₋₆アルキルで1もしくは2個置換されていてもよいアミノ、C₁₋₆アルコキシ、フェニルまたはハロゲン原子で1〜3個置換されていてもよいC₁₋₁₀アルカノイル基、(3) C₄₋₁₀シクロアルカノイル基、(4) C₃₋₁₀アルケニルカルボニル基、(5) ベンゾイル基、(6) フェニルで置換されていてもよいC₁₋₆アルキル、C₃₋₉シクロアルキル、C₂₋₈アルケニル、C₂₋₆アルキニル、フェニル、C₁₋₆アルキルで1もしくは2個置換されていてもよいアミノ、環状アミノ、ヒドロキシルまたはC₁₋₆アルコキシで1もしくは2個置換されていてもよいカルバモイル基、(7) 環状アミノカルボニル基、(8) C₁₋₆アルコキシカルボニル基または(9) ホルミル基が好ましい。化合物(III)としては以下に示す表37〜70に示される化合物またはその塩が好ましく用いられる。

【0081】

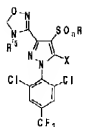
【表37】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
1-1	0	CF ₃	MeCO	N = CHOMe	
1-2	1	CF ₃	MeCO	N = CHOMe	126-127
1-3	2	CF ₃	MeCO	N = CHOMe	
1-4	0	CF ₃	MeCO	N = CHOEt	
1-5	1	CF ₃	MeCO	N = CHOEt	116-118
1-6	2	CF ₃	MeCO	N = CHOEt	
1-7	0	CF ₃	MeCO	N = CHOPr-n	101-103
1-8	1	CF ₃	MeCO	N = CHOPr-n	
1-9	2	CF ₃	MeCO	N = CHOPr-n	
1-10	0	CF ₃	MeCO	N = CHOPr-i	
1-11	1	CF ₃	MeCO	N = CHOPr-i	
1-12	2	CF ₃	MeCO	N = CHOPr-i	
1-13	0	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-n	
1-14	1	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-n	
1-15	2	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-n	
1-16	0	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-i	
1-17	1	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-i	
1-18	2	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-i	
1-19	0	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-s	
1-20	1	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-s	
1-21	2	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-s	
1-22	0	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-t	
1-23	1	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-t	
1-24	2	CF ₃	MeCO	N = CHOBu-t	
1-25	0	CF ₃	MeCO	NH ₂	
1-26	1	CF ₃	MeCO	NH ₂	161-164
1-27	2	CF ₃	MeCO	NH ₂	

【0082】

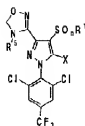
* * 【表38】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
2-1	0	CF ₃	EtCO	N = CHOMe	
2-2	1	CF ₃	EtCO	N = CHOMe	
2-3	2	CF ₃	EtCO	N = CHOMe	
2-4	0	CF ₃	EtCO	N = CHOEt	
2-5	1	CF ₃	EtCO	N = CHOEt	114-115
2-6	2	CF ₃	EtCO	N = CHOEt	
2-7	0	CF ₃	EtCO	N = CHOPr-n	
2-8	1	CF ₃	EtCO	N = CHOPr-n	85-86
2-9	2	CF ₃	EtCO	N = CHOPr-n	
2-10	0	CF ₃	EtCO	N = CHOPr-i	
2-11	1	CF ₃	EtCO	N = CHOPr-i	
2-12	2	CF ₃	EtCO	N = CHOPr-i	
2-13	0	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-n	
2-14	1	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-n	
2-15	2	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-n	
2-16	0	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-i	
2-17	1	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-i	
2-18	2	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-i	
2-19	0	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-s	
2-20	1	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-s	
2-21	2	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-s	
2-22	0	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-t	
2-23	1	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-t	
2-24	2	CF ₃	EtCO	N = CHOBu-t	
2-25	0	CF ₃	EtCO	NH ₂	
2-26	1	CF ₃	EtCO	NH ₂	
2-27	2	CF ₃	EtCO	NH ₂	

【0083】

* * 【表39】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
3-1	0	CF ₃	n-PrCO	N = CHOMe	
3-2	1	CF ₃	n-PrCO	N = CHOMe	
3-3	2	CF ₃	n-PrCO	N = CHOMe	
3-4	0	CF ₃	n-PrCO	N = CHOEt	
3-5	1	CF ₃	n-PrCO	N = CHOEt	88-89
3-6	2	CF ₃	n-PrCO	N = CHOEt	
3-7	0	CF ₃	n-PrCO	N = CHOPr-n	
3-8	1	CF ₃	n-PrCO	N = CHOPr-n	
3-9	2	CF ₃	n-PrCO	N = CHOPr-n	
3-10	0	CF ₃	n-PrCO	N = CHOPr-i	
3-11	1	CF ₃	n-PrCO	N = CHOPr-i	
3-12	2	CF ₃	n-PrCO	N = CHOPr-i	
3-13	0	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-n	
3-14	1	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-n	
3-15	2	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-n	
3-16	0	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-i	
3-17	1	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-i	
3-18	2	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-i	
3-19	0	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-s	
3-20	1	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-s	
3-21	2	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-s	
3-22	0	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-t	
3-23	1	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-t	
3-24	2	CF ₃	n-PrCO	N = CHOBu-t	
3-25	0	CF ₃	n-PrCO	NH ₂	
3-26	1	CF ₃	n-PrCO	NH ₂	
3-27	2	CF ₃	n-PrCO	NH ₂	

【0084】

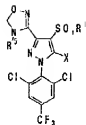
* * 【表40】



Comp.No.	n	R ¹	R ¹	X	mp. (°C)
4-1	0	CF ₃	i-PrCO	N = CHOMe	
4-2	1	CF ₃	i-PrCO	N = CHOMe	
4-3	2	CF ₃	i-PrCO	N = CHOMe	
4-4	0	CF ₃	i-PrCO	N = CHOEt	(油状物) ¹⁾
4-5	1	CF ₃	i-PrCO	N = CHOEt	(油状物) ²⁾
4-6	2	CF ₃	i-PrCO	N = CHOEt	99-100
4-7	0	CF ₃	i-PrCO	N = CHOPr-n	
4-8	1	CF ₃	i-PrCO	N = CHOPr-n	
4-9	2	CF ₃	i-PrCO	N = CHOPr-n	
4-10	0	CF ₃	i-PrCO	N = CHOPr-i	
4-11	1	CF ₃	i-PrCO	N = CHOPr-i	
4-12	2	CF ₃	i-PrCO	N = CHOPr-i	
4-13	0	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-n	
4-14	1	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-n	
4-15	2	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-n	
4-16	0	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-i	
4-17	1	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-i	
4-18	2	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-i	
4-19	0	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-s	
4-20	1	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-s	
4-21	2	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-s	
4-22	0	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-t	
4-23	1	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-t	
4-24	2	CF ₃	i-PrCO	N = CHOBu-t	
4-25	0	CF ₃	i-PrCO	NH ₂	
4-26	1	CF ₃	i-PrCO	NH ₂	
4-27	2	CF ₃	i-PrCO	NH ₂	

【0085】

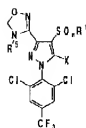
* * 【表41】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
5-1	0	CF ₃	n-BuCO	N = CHOMe	
5-2	1	CF ₃	n-BuCO	N = CHOMe	
5-3	2	CF ₃	n-BuCO	N = CHOMe	
5-4	0	CF ₃	n-BuCO	N = CHOEt	
5-5	1	CF ₃	n-BuCO	N = CHOEt	96-96.5
5-6	2	CF ₃	n-BuCO	N = CHOEt	
5-7	0	CF ₃	n-BuCO	N = CHOPr-n	
5-8	1	CF ₃	n-BuCO	N = CHOPr-n	
5-9	2	CF ₃	n-BuCO	N = CHOPr-n	
5-10	0	CF ₃	n-BuCO	N = CHOPr-i	
5-11	1	CF ₃	n-BuCO	N = CHOPr-i	
5-12	2	CF ₃	n-BuCO	N = CHOPr-i	
5-13	0	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-n	
5-14	1	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-n	
5-15	2	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-n	
5-16	0	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-i	
5-17	1	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-i	
5-18	2	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-i	
5-19	0	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-s	
5-20	1	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-s	
5-21	2	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-s	
5-22	0	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-t	
5-23	1	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-t	
5-24	2	CF ₃	n-BuCO	N = CHOBu-t	
5-25	0	CF ₃	n-BuCO	NH ₂	
5-26	1	CF ₃	n-BuCO	NH ₂	
5-27	2	CF ₃	n-BuCO	NH ₂	

【0086】

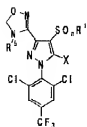
* * 【表42】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
6-1	0	CF ₃	i-BuCO	N = CHOMe	104-105
6-2	1	CF ₃	i-BuCO	N = CHOMe	
6-3	2	CF ₃	i-BuCO	N = CHOMe	
6-4	0	CF ₃	i-BuCO	N = CHOEt	
6-5	1	CF ₃	i-BuCO	N = CHOEt	
6-6	2	CF ₃	i-BuCO	N = CHOEt	
6-7	0	CF ₃	i-BuCO	N = CHOPr-n	
6-8	1	CF ₃	i-BuCO	N = CHOPr-n	
6-9	2	CF ₃	i-BuCO	N = CHOPr-n	
6-10	0	CF ₃	i-BuCO	N = CHOPr-i	
6-11	1	CF ₃	i-BuCO	N = CHOPr-i	
6-12	2	CF ₃	i-BuCO	N = CHOPr-i	
6-13	0	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-n	
6-14	1	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-n	
6-15	2	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-n	
6-16	0	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-i	
6-17	1	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-i	
6-18	2	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-i	
6-19	0	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-s	
6-20	1	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-s	
6-21	2	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-s	
6-22	0	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-t	
6-23	1	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-t	
6-24	2	CF ₃	i-BuCO	N = CHOBu-t	
6-25	0	CF ₃	i-BuCO	NH ₂	
6-26	1	CF ₃	i-BuCO	NH ₂	
6-27	2	CF ₃	i-BuCO	NH ₂	

【0087】

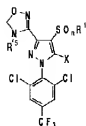
* * 【表43】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
7-1	0	CF ₃	s-BuCO	N = CHOMe	
7-2	1	CF ₃	s-BuCO	N = CHOMe	
7-3	2	CF ₃	s-BuCO	N = CHOMe	
7-4	0	CF ₃	s-BuCO	N = CHOEi	(油状物) ^a
7-5	1	CF ₃	s-BuCO	N = CHOEi	92-93
7-6	2	CF ₃	s-BuCO	N = CHOEi	102.5-105
7-7	0	CF ₃	s-BuCO	N = CHOPr-n	
7-8	1	CF ₃	s-BuCO	N = CHOPr-n	
7-9	2	CF ₃	s-BuCO	N = CHOPr-n	
7-10	0	CF ₃	s-BuCO	N = CHOPr-i	
7-11	1	CF ₃	s-BuCO	N = CHOPr-i	
7-12	2	CF ₃	s-BuCO	N = CHOPr-i	
7-13	0	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-n	
7-14	1	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-n	
7-15	2	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-n	
7-16	0	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-i	
7-17	1	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-i	
7-18	2	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-i	
7-19	0	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-s	
7-20	1	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-s	
7-21	2	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-s	
7-22	0	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-t	
7-23	1	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-t	
7-24	2	CF ₃	s-BuCO	N = CHOBu-t	
7-25	0	CF ₃	s-BuCO	NH	
7-26	1	CF ₃	s-BuCO	NH	
7-27	2	CF ₃	s-BuCO	NH	

【0088】

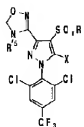
* * 【表44】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
8-1	0	CF ₃	t-BuCO	N = CHOMe	
8-2	1	CF ₃	t-BuCO	N = CHOMe	
8-3	2	CF ₃	t-BuCO	N = CHOMe	
8-4	0	CF ₃	t-BuCO	N = CHOEt	(74.7-75.1) °
8-5	1	CF ₃	t-BuCO	N = CHOEt	133.5-134
8-6	2	CF ₃	t-BuCO	N = CHOEt	126-127
8-7	0	CF ₃	t-BuCO	N = CHOPr-n	
8-8	1	CF ₃	t-BuCO	N = CHOPr-n	
8-9	2	CF ₃	t-BuCO	N = CHOPr-n	
8-10	0	CF ₃	t-BuCO	N = CHOPr-i	
8-11	1	CF ₃	t-BuCO	N = CHOPr-i	
8-12	2	CF ₃	t-BuCO	N = CHOPr-i	
8-13	0	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-n	
8-14	1	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-n	
8-15	2	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-n	
8-16	0	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-i	
8-17	1	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-i	
8-18	2	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-i	
8-19	0	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-s	
8-20	1	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-s	
8-21	2	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-s	
8-22	0	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-t	
8-23	1	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-t	
8-24	2	CF ₃	t-BuCO	N = CHOBu-t	
8-25	0	CF ₃	t-BuCO	NH ₂	
8-26	1	CF ₃	t-BuCO	NH ₂	
8-27	2	CF ₃	t-BuCO	NH ₂	

【0089】

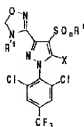
* * 【表45】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
9-1	0	CF ₃	PhCO	N = CHOMe	138-139
9-2	1	CF ₃	PhCO	N = CHOMe	
9-3	2	CF ₃	PhCO	N = CHOMe	
9-4	0	CF ₃	PhCO	N = CHOEt	
9-5	1	CF ₃	PhCO	N = CHOEt	
9-6	2	CF ₃	PhCO	N = CHOEt	
9-7	0	CF ₃	PhCO	N = CHOPt-n	
9-8	1	CF ₃	PhCO	N = CHOPt-n	
9-9	2	CF ₃	PhCO	N = CHOPt-n	
9-10	0	CF ₃	PhCO	N = CHOPt-i	
9-11	1	CF ₃	PhCO	N = CHOPt-i	
9-12	2	CF ₃	PhCO	N = CHOPt-i	
9-13	0	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-n	
9-14	1	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-n	
9-15	2	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-n	
9-16	0	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-i	
9-17	1	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-i	
9-18	2	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-i	
9-19	0	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-s	
9-20	1	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-s	
9-21	2	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-s	
9-22	0	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-t	
9-23	1	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-t	
9-24	2	CF ₃	PhCO	N = CHOBu-t	
9-25	0	CF ₃	PhCO	NH	
9-26	1	CF ₃	PhCO	NH	
9-27	2	CF ₃	PhCO	NH	

【0090】

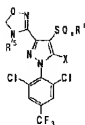
* * 【表46】



Comp.No.	n	R ¹	R ¹	X	mp. (°C)
10-1	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOMe	135
10-2	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOMe	
10-3	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOMe	
10-4	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOEt	
10-5	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOEt	
10-6	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOEt	
10-7	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOPr-n	
10-8	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOPr-n	
10-9	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOPr-n	
10-10	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOPr-i	
10-11	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOPr-i	
10-12	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOPr-i	
10-13	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-n	
10-14	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-n	
10-15	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-n	
10-16	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-i	
10-17	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-i	
10-18	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-i	
10-19	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-s	
10-20	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-s	
10-21	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-s	
10-22	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-t	
10-23	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-t	
10-24	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	N = CHOBu-t	
10-25	0	CF ₃	MeNCH ₂ CO	NH ₂	
10-26	1	CF ₃	MeNCH ₂ CO	NH ₂	
10-27	2	CF ₃	MeNCH ₂ CO	NH ₂	

【0091】

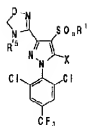
* * 【表47】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
11-1	0	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOMe	86.5-87
11-2	1	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOMe	
11-3	2	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOMe	
11-4	0	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOEt	
11-5	1	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOEt	
11-6	2	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOEt	
11-7	0	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOPr-n	
11-8	1	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOPr-n	
11-9	2	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOPr-n	
11-10	0	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOPr-i	
11-11	1	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOPr-i	
11-12	2	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOPr-i	
11-13	0	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-n	
11-14	1	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-n	
11-15	2	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-n	121-122
11-16	0	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-i	
11-17	1	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-i	
11-18	2	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-i	
11-19	0	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-s	
11-20	1	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-s	
11-21	2	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-s	
11-22	0	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-t	
11-23	1	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-t	
11-24	2	CF ₃	H ₂ NCO	N = CHOBu-t	
11-25	0	CF ₃	H ₂ NCO	NH ₂	
11-26	1	CF ₃	H ₂ NCO	NH ₂	
11-27	2	CF ₃	H ₂ NCO	NH ₂	

【0092】

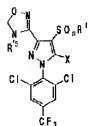
* * 【表48】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
12-1	0	CF ₃	MeNHCO	N = CHOMe	115-116
12-2	1	CF ₃	MeNHCO	N = CHOMe	
12-3	2	CF ₃	MeNHCO	N = CHOMe	
12-4	0	CF ₃	MeNHCO	N = CHOEt	
12-5	1	CF ₃	MeNHCO	N = CHOEt	
12-6	2	CF ₃	MeNHCO	N = CHOEt	
12-7	0	CF ₃	MeNHCO	N = CHOPr-n	
12-8	1	CF ₃	MeNHCO	N = CHOPr-n	
12-9	2	CF ₃	MeNHCO	N = CHOPr-n	
12-10	0	CF ₃	MeNHCO	N = CHOPr-i	
12-11	1	CF ₃	MeNHCO	N = CHOPr-i	
12-12	2	CF ₃	MeNHCO	N = CHOPr-i	
12-13	0	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-n	
12-14	1	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-n	
12-15	2	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-n	
12-16	0	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-i	
12-17	1	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-i	
12-18	2	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-i	
12-19	0	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-s	
12-20	1	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-s	
12-21	2	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-s	
12-22	0	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-t	
12-23	1	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-t	
12-24	2	CF ₃	MeNHCO	N = CHOBu-t	
12-25	0	CF ₃	MeNHCO	NH ₂	
12-26	1	CF ₃	MeNHCO	NH ₂	
12-27	2	CF ₃	MeNHCO	NH ₂	

【0093】

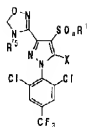
* * 【表49】



Comp.No.	n	R ¹	R ³	X	mp. (°C)
13-1	0	CF ₃	EtNHCO	N = CHOMe	151-152
13-2	1	CF ₃	EtNHCO	N = CHOMe	
13-3	2	CF ₃	EtNHCO	N = CHOMe	
13-4	0	CF ₃	EtNHCO	N = CHOE	
13-5	1	CF ₃	EtNHCO	N = CHOE	
13-6	2	CF ₃	EtNHCO	N = CHOE	
13-7	0	CF ₃	EtNHCO	N = CHOPr-n	
13-8	1	CF ₃	EtNHCO	N = CHOPr-n	
13-9	2	CF ₃	EtNHCO	N = CHOPr-n	
13-10	0	CF ₃	EtNHCO	N = CHOPr-i	
13-11	1	CF ₃	EtNHCO	N = CHOPr-i	
13-12	2	CF ₃	EtNHCO	N = CHOPr-i	
13-13	0	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-n	
13-14	1	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-n	
13-15	2	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-n	
13-16	0	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-i	
13-17	1	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-i	
13-18	2	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-i	
13-19	0	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-s	
13-20	1	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-s	
13-21	2	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-s	
13-22	0	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-t	
13-23	1	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-t	
13-24	2	CF ₃	EtNHCO	N = CHOBu-t	
13-25	0	CF ₃	EtNHCO	NH	
13-26	1	CF ₃	EtNHCO	NH	
13-27	2	CF ₃	EtNHCO	NH	

【0094】

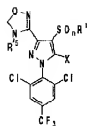
* * 【表50】



Comp.No.	n	R ¹	R ¹	X	mp. (°C)
14-1	0	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOMe	151-152
14-2	1	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOMe	
14-3	2	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOMe	
14-4	0	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOEt	
14-5	1	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOEt	
14-6	2	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOEt	
14-7	0	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOPr-n	
14-8	1	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOPr-n	
14-9	2	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOPr-n	
14-10	0	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOPr-i	
14-11	1	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOPr-i	
14-12	2	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOPr-i	
14-13	0	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-n	
14-14	1	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-n	
14-15	2	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-n	
14-16	0	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-i	
14-17	1	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-i	
14-18	2	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-i	
14-19	0	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-s	
14-20	1	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-s	
14-21	2	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-s	
14-22	0	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-t	
14-23	1	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-t	
14-24	2	CF ₃	n-PrNHCO	N = CHOBu-t	
14-25	0	CF ₃	n-PrNHCO	NH ₂	
14-26	1	CF ₃	n-PrNHCO	NH ₂	
14-27	2	CF ₃	n-PrNHCO	NH ₂	

【0095】

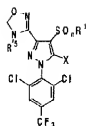
* * 【表51】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
15-1	0	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOMe	160-162
15-2	1	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOMe	
15-3	2	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOMe	
15-4	0	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOEt	
15-5	1	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOEt	
15-6	2	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOEt	
15-7	0	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOPr-n	
15-8	1	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOPr-n	
15-9	2	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOPr-n	
15-10	0	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOPr-i	
15-11	1	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOPr-i	
15-12	2	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOPr-i	
15-13	0	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-n	
15-14	1	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-n	
15-15	2	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-n	
15-16	0	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-i	
15-17	1	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-i	
15-18	2	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-i	
15-19	0	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-s	
15-20	1	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-s	
15-21	2	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-s	
15-22	0	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-t	
15-23	1	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-t	
15-24	2	CF ₃	i-PrNHCO	N = CHOBu-t	
15-25	0	CF ₃	i-PrNHCO	NH ₂	
15-26	1	CF ₃	i-PrNHCO	NH ₂	
15-27	2	CF ₃	i-PrNHCO	NH ₂	

【0096】

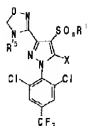
* * 【表52】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
16-1	0	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOMe	127-128
16-2	1	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOMe	
16-3	2	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOMe	
16-4	0	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOEt	
16-5	1	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOEt	
16-6	2	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOEt	
16-7	0	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOPr-n	
16-8	1	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOPr-n	
16-9	2	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOPr-n	
16-10	0	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOPr-i	
16-11	1	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOPr-i	
16-12	2	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOPr-i	
16-13	0	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-n	
16-14	1	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-n	
16-15	2	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-n	
16-16	0	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-i	
16-17	1	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-i	
16-18	2	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-i	
16-19	0	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-s	
16-20	1	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-s	
16-21	2	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-s	
16-22	0	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-t	
16-23	1	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-t	
16-24	2	CF ₃	n-BuNHCO	N = CHOBu-t	
16-25	0	CF ₃	n-BuNHCO	NH	
16-26	1	CF ₃	n-BuNHCO	NH	
16-27	2	CF ₃	n-BuNHCO	NH	

【0097】

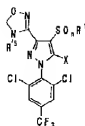
* * 【表53】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
17-1	0	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOMe	
17-2	1	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOMe	
17-3	2	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOMe	
17-4	0	CF ₃	i-BuNHCO	N = ClHOEt	
17-5	1	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOEt	
17-6	2	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOEt	
17-7	0	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOPr-n	
17-8	1	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOPr-n	
17-9	2	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOPr-n	
17-10	0	CF ₃	i-BuNHCO	N = ClHOPr-i	
17-11	1	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOPr-i	
17-12	2	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOPr-i	
17-13	0	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-n	
17-14	1	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-n	
17-15	2	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-n	
17-16	0	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-i	
17-17	1	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-i	
17-18	2	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-i	
17-19	0	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-s	
17-20	1	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-s	
17-21	2	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-s	
17-22	0	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-t	
17-23	1	CF ₃	i-BuNHCO	N = CHOBu-t	
17-24	2	CF ₃	i-BuNHCO	N = ClHOBu-t	
17-25	0	CF ₃	i-BuNHCO	NH	
17-26	1	CF ₃	i-BuNHCO	NH	215-217
17-27	2	CF ₃	i-BuNHCO	NH	

【0098】

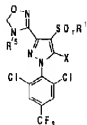
* * 【表54】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp (°C)
18-1	0	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOMe	
18-2	1	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOMe	
18-3	2	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOMe	
18-4	0	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOEi	
18-5	1	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOEi	120-121
18-6	2	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOEi	
18-7	0	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOPr-n	
18-8	1	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOPr-n	
18-9	2	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOPr-n	
18-10	0	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOPr-i	
18-11	1	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOPr-i	
18-12	2	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOPr-i	
18-13	0	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-n	
18-14	1	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-n	
18-15	2	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-n	
18-16	0	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-i	
18-17	1	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-i	
18-18	2	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-i	
18-19	0	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-s	
18-20	1	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-s	
18-21	2	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-s	
18-22	0	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-t	
18-23	1	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-t	
18-24	2	CF ₃	t-BuNHCO	N = CHOBu-t	
18-25	0	CF ₃	t-BuNHCO	NH ₂	
18-26	1	CF ₃	t-BuNHCO	NH ₂	
18-27	2	CF ₃	t-BuNHCO	NH ₂	

【0099】

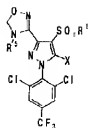
* * 【表55】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
19-1	0	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOMe	
19-2	1	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOMe	
19-3	2	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOMe	
19-4	0	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOEt	
19-5	1	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOEt	
19-6	2	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOEt	
19-7	0	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOPr-n	
19-8	1	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOPr-n	
19-9	2	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOPr-n	
19-10	0	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOPr-i	
19-11	1	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOPr-i	
19-12	2	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOPr-i	
19-13	0	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-n	
19-14	1	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-n	
19-15	2	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-n	
19-16	0	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-i	
19-17	1	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-i	
19-18	2	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-i	
19-19	0	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-s	
19-20	1	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-s	
19-21	2	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-s	
19-22	0	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-t	
19-23	1	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-t	
19-24	2	CF ₃	s-BuNHCO	N = CHOBu-t	
19-25	0	CF ₃	s-BuNHCO	NH ₂	
19-26	1	CF ₃	s-BuNHCO	NH ₂	
19-27	2	CF ₃	s-BuNHCO	NH ₂	

【0100】

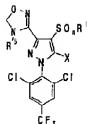
* * 【表56】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
20-1	0	CF ₃	MeNCO	N = CHOMe	
20-2	1	CF ₃	MeNCO	N = CHOMe	
20-3	2	CF ₃	MeNCO	N = CHOMe	
20-4	0	CF ₃	MeNCO	N = CHOEt	93-94
20-5	1	CF ₃	MeNCO	N = CHOEt	(74/77%) ¹⁾
20-6	2	CF ₃	MeNCO	N = CHOEt	102-103
20-7	0	CF ₃	MeNCO	N = CHOPr-n	51-54
20-8	1	CF ₃	MeNCO	N = CHOPr-n	
20-9	2	CF ₃	MeNCO	N = CHOPr-n	
20-10	0	CF ₃	MeNCO	N = CHOPr-i	112-113
20-11	1	CF ₃	MeNCO	N = CHOPr-i	(74/77%) ¹⁾
20-12	2	CF ₃	MeNCO	N = CHOPr-i	(74/77%) ¹⁾
20-13	0	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-n	(74/77%) ¹⁾
20-14	1	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-n	130-131
20-15	2	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-n	96.5-97.5
20-16	0	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-i	
20-17	1	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-i	
20-18	2	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-i	
20-19	0	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-s	
20-20	1	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-s	
20-21	2	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-s	
20-22	0	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-t	
20-23	1	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-t	
20-24	2	CF ₃	MeNCO	N = CHOBu-t	
20-25	0	CF ₃	MeNCO	NH ₂	191-193
20-26	1	CF ₃	MeNCO	NH ₂	207-207.5
20-27	2	CF ₃	MeNCO	NH ₂	240.5-241

【0101】

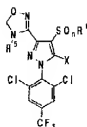
* * 【表57】



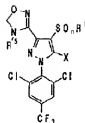
Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
21-1	0	CF ₃	EtNCO	N = CHOMe	
21-2	1	CF ₃	EtNCO	N = CHOMe	
21-3	2	CF ₃	EtNCO	N = CHOMe	
21-4	0	CF ₃	EtNCO	N = CHOEi	93-95
21-5	1	CF ₃	EtNCO	N = CHOEi	107-108
21-6	2	CF ₃	EtNCO	N = CHOEi	105.5-106.5
21-7	0	CF ₃	EtNCO	N = CHOPr-n	100-102
21-8	1	CF ₃	EtNCO	N = CHOPr-n	(油状物) ¹⁰⁾
21-9	2	CF ₃	EtNCO	N = CHOPr-n	(油状物) ¹⁰⁾
21-10	0	CF ₃	EtNCO	N = CHOPr-i	(75/77%) ¹¹⁾
21-11	1	CF ₃	EtNCO	N = CHOPr-i	106-107
21-12	2	CF ₃	EtNCO	N = CHOPr-i	(75/77%) ¹²⁾
21-13	0	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-n	(油状物) ¹³⁾
21-14	1	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-n	104.5-105
21-15	2	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-n	(油状物) ¹⁴⁾
21-16	0	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-i	
21-17	1	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-i	
21-18	2	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-i	
21-19	0	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-s	
21-20	1	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-s	
21-21	2	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-s	
21-22	0	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-t	
21-23	1	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-t	
21-24	2	CF ₃	EtNCO	N = CHOBu-t	
21-25	0	CF ₃	EtNCO	NH ₂	81-83
21-26	1	CF ₃	EtNCO	NH ₂	98-99
21-27	2	CF ₃	EtNCO	NH ₂	197-198

【0102】

* * 【表58】



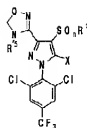
Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
22-1	0	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOMe	
22-2	1	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOMe	
22-3	2	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOMe	
22-4	0	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOEt	83-85
22-5	1	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOEt	113-114
22-6	2	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOEt	(78/77λ) ⁽¹⁾
22-7	0	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOPr-n	
22-8	1	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOPr-n	
22-9	2	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOPr-n	
22-10	0	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOPr-i	(油状物) ⁽¹⁾
22-11	1	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOPr-i	126-128
22-12	2	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOPr-i	(78/77λ) ⁽¹⁾
22-13	0	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-n	(油状物) ⁽¹⁾
22-14	1	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-n	126-126.5
22-15	2	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-n	(油状物) ⁽¹⁾
22-16	0	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-i	
22-17	1	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-i	
22-18	2	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-i	
22-19	0	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-s	
22-20	1	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-s	
22-21	2	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-s	
22-22	0	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-t	
22-23	1	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-t	
22-24	2	CF ₃	MeEtNCO	N = CHOBu-t	
22-25	0	CF ₃	MeEtNCO	NH	141-143
22-26	1	CF ₃	MeEtNCO	NH	165-166
22-27	2	CF ₃	MeEtNCO	NH	215-215.5



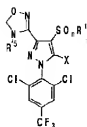
Comp.No.	n	R	R'	X	mp. (°C)
23-1	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOMe	
23-2	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOMe	
23-3	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOMe	
23-4	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOEt	
23-5	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOEt	
23-6	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOEt	
23-7	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOPr-n	
23-8	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOPr-n	
23-9	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOPr-n	
23-10	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOPr-i	
23-11	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOPr-i	
23-12	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOPr-i	
23-13	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-n	
23-14	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-n	
23-15	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-n	
23-16	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-i	
23-17	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-i	
23-18	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-i	
23-19	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-s	
23-20	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-s	
23-21	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-s	
23-22	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-t	
23-23	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-t	
23-24	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	N = CHOBu-t	
23-25	0	CF ₃	(EtO) ₂ CH	NH ₂	
23-26	1	CF ₃	(EtO) ₂ CH	NH ₂	
23-27	2	CF ₃	(EtO) ₂ CH	NH ₂	218-220

【0104】

* * 【表60】



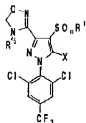
Comp.No.	n	R'	R'	X	mp. (°C)
24-1	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOMe	95-97
24-2	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOMe	
24-3	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOMe	
24-4	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOEt	
24-5	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOEt	
24-6	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOEt	
24-7	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOPr-n	
24-8	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOPr-n	
24-9	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOPr-n	
24-10	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOPr-i	
24-11	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOPr-i	
24-12	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOPr-i	
24-13	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-n	
24-14	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-n	
24-15	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-n	
24-16	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-i	173-176
24-17	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-i	
24-18	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-i	
24-19	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-s	
24-20	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-s	
24-21	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-s	
24-22	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-t	
24-23	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-t	
24-24	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	N = CHOBu-t	
24-25	0	CF ₃	(PrO) ₂ CH	NH ₂	
24-26	1	CF ₃	(PrO) ₂ CH	NH ₂	
24-27	2	CF ₃	(PrO) ₂ CH	NH ₂	



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
25-1	0	CF ₃	Me	N = CHOMe	
25-2	1	CF ₃	Me	N = CHOMe	
25-3	2	CF ₃	Me	N = CHOMe	
25-4	0	CF ₃	Me	N = CHOEt	
25-5	1	CF ₃	Me	N = CHOEt	
25-6	2	CF ₃	Me	N = CHOEt	
25-7	0	CF ₃	Me	N = CHOPr-n	
25-8	1	CF ₃	Me	N = CHOPr-n	
25-9	2	CF ₃	Me	N = CHOPr-n	
25-10	0	CF ₃	Me	N = CHOPr-i	
25-11	1	CF ₃	Me	N = CHOPr-i	
25-12	2	CF ₃	Me	N = CHOPr-i	
25-13	0	CF ₃	Me	N = CHOBu-n	
25-14	1	CF ₃	Me	N = CHOBu-n	
25-15	2	CF ₃	Me	N = CHOBu-n	
25-16	0	CF ₃	Me	N = CHOBu-i	
25-17	1	CF ₃	Me	N = CHOBu-i	
25-18	2	CF ₃	Me	N = CHOBu-i	
25-19	0	CF ₃	Me	N = CHOBu-s	
25-20	1	CF ₃	Me	N = CHOBu-s	
25-21	2	CF ₃	Me	N = CHOBu-s	
25-22	0	CF ₃	Me	N = CHOBu-t	
25-23	1	CF ₃	Me	N = CHOBu-t	
25-24	2	CF ₃	Me	N = CHOBu-t	
25-25	0	CF ₃	Me	NH ₂	
25-26	1	CF ₃	Me	NH ₂	
25-27	2	CF ₃	Me	NH ₂	

【0106】

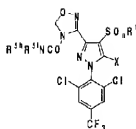
* * 【表62】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
26-1	0	CF ₃	Et	N = CHOMe	
26-2	1	CF ₃	Et	N = CHOMe	
26-3	2	CF ₃	Et	N = CHOMe	
26-4	0	CF ₃	Et	N = CHOEt	
26-5	1	CF ₃	Et	N = CHOEt	
26-6	2	CF ₃	Et	N = CHOEt	
26-7	0	CF ₃	Et	N = CHOPr-n	
26-8	1	CF ₃	Et	N = CHOPr-n	
26-9	2	CF ₃	Et	N = CHOPr-n	
26-10	0	CF ₃	Et	N = CHOPr-i	
26-11	1	CF ₃	Et	N = CHOPr-i	
26-12	2	CF ₃	Et	N = CHOPr-i	
26-13	0	CF ₃	Et	N = CHOBu-n	
26-14	1	CF ₃	Et	N = CHOBu-n	
26-15	2	CF ₃	Et	N = CHOBu-n	
26-16	0	CF ₃	Et	N = CHOBu-i	
26-17	1	CF ₃	Et	N = CHOBu-i	
26-18	2	CF ₃	Et	N = CHOBu-i	
26-19	0	CF ₃	Et	N = CHOBu-s	
26-20	1	CF ₃	Et	N = CHOBu-s	
26-21	2	CF ₃	Et	N = CHOBu-s	
26-22	0	CF ₃	Et	N = CHOBu-t	
26-23	1	CF ₃	Et	N = CHOBu-t	
26-24	2	CF ₃	Et	N = CHOBu-t	
26-25	0	CF ₃	Et	NH ₂	
26-26	1	CF ₃	Et	NH ₂	(75/72) ²⁰⁾
26-27	2	CF ₃	Et	NH ₂	

【0107】

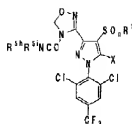
40【表63】



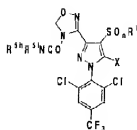
Comp.No.	n	R ¹	R ¹³	R ¹⁴	X	mp. (°C)
27-1	0	CF ₃	Me	n-Pr	N=CHOEt	
27-2	1	CF ₃	Me	n-Pr	N=CHOEt	106-108
27-3	2	CF ₃	Me	n-Pr	N=CHOEt	
27-4	0	CF ₃	Me	i-Pr	N=CHOEt	126-128
27-5	1	CF ₃	Me	i-Pr	N=CHOEt	96-98
27-6	2	CF ₃	Me	i-Pr	N=CHOEt	(油状物) ²¹¹⁾
27-7	0	CF ₃	Me	n-Bu	N=CHOEt	
27-8	1	CF ₃	Me	n-Bu	N=CHOEt	82-83
27-9	2	CF ₃	Me	n-Bu	N=CHOEt	
27-10	0	CF ₃	Me	i-Bu	N=CHOEt	
27-11	1	CF ₃	Me	i-Bu	N=CHOEt	102-103
27-12	2	CF ₃	Me	i-Bu	N=CHOEt	
27-13	0	CF ₃	Me	s-Bu	N=CHOEt	
27-14	1	CF ₃	Me	s-Bu	N=CHOEt	
27-15	2	CF ₃	Me	s-Bu	N=CHOEt	
27-16	0	CF ₃	Me	t-Bu	N=CHOEt	(油状物) ²¹²⁾
27-17	1	CF ₃	Me	t-Bu	N=CHOEt	(75%77%) ²¹³⁾
27-18	2	CF ₃	Me	t-Bu	N=CHOEt	(75%77%) ²¹⁴⁾
27-19	0	CF ₃	Et	n-Pr	N=CHOEt	
27-20	1	CF ₃	Et	n-Pr	N=CHOEt	101-102
27-21	2	CF ₃	Et	n-Pr	N=CHOEt	
27-22	0	CF ₃	Et	i-Pr	N=CHOEt	
27-23	1	CF ₃	Et	i-Pr	N=CHOEt	(75%77%) ²¹⁵⁾
27-24	2	CF ₃	Et	i-Pr	N=CHOEt	
27-25	0	CF ₃	Et	n-Bu	N=CHOEt	
27-26	1	CF ₃	Et	n-Bu	N=CHOEt	84-85
27-27	2	CF ₃	Et	n-Bu	N=CHOEt	

{0108}

* *【表64】



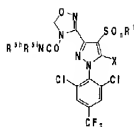
Comp.No.	n	R ¹	R ¹⁸	R ¹⁹	X	mp. (°C)
28-1	0	CF ₃	Et	i-Bu	N=CHOEt	
28-2	1	CF ₃	Et	i-Bu	N=CHOEt	
28-3	2	CF ₃	Et	i-Bu	N=CHOEt	
28-4	0	CF ₃	Et	s-Bu	N=CHOEt	
28-5	1	CF ₃	Et	s-Bu	N=CHOEt	
28-6	2	CF ₃	Et	s-Bu	N=CHOEt	
28-7	0	CF ₃	Et	t-Bu	N=CHOEt	
28-8	1	CF ₃	Et	t-Bu	N=CHOEt	113-114
28-9	2	CF ₃	Et	t-Bu	N=CHOEt	
28-10	0	CF ₃	n-Pr	n-Pr	N=CHOEt	
28-11	1	CF ₃	n-Pr	n-Pr	N=CHOEt	109-111
28-12	2	CF ₃	n-Pr	n-Pr	N=CHOEt	
28-13	0	CF ₃	n-Bu	n-Bu	N=CHOEt	
28-14	1	CF ₃	n-Bu	n-Bu	N=CHOEt	97-98
28-15	2	CF ₃	n-Bu	n-Bu	N=CHOEt	
28-16	0	CF ₃	i-Bu	i-Bu	N=CHOEt	
28-17	1	CF ₃	i-Bu	i-Bu	N=CHOEt	114-115
28-18	2	CF ₃	i-Bu	i-Bu	N=CHOEt	
28-19	0	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	
28-20	1	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	140-142
28-21	2	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	
28-22	0	CF ₃	Me	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	
28-23	1	CF ₃	Me	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	(油状物) ^m
28-24	2	CF ₃	Me	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	
28-25	0	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	
28-26	1	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	132-133
28-27	2	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	N=CHOEt	



Comp.No.	n	R ¹	R ^b	R ⁵	X	mp. (°C)
29-1	0	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	N=CHOEt	
29-2	1	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	N=CHOEt	126-128
29-3	2	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	N=CHOEt	
29-4	0	CF ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	N=CHOEt	
29-5	1	CF ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	N=CHOEt	122-124
29-6	2	CF ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	N=CHOEt	
29-7	0	CF ₃	H	Ph	N=CHOEt	
29-8	1	CF ₃	H	Ph	N=CHOEt	146-148
29-9	2	CF ₃	H	Ph	N=CHOEt	
29-10	0	CF ₃	Me	Ph	N=CHOEt	
29-11	1	CF ₃	Me	Ph	N=CHOEt	154-155
29-12	2	CF ₃	Me	Ph	N=CHOEt	
29-13	0	CF ₃	Me	CH ₂ Ph	N=CHOEt	
29-14	1	CF ₃	Me	CH ₂ Ph	N=CHOEt	124-126
29-15	2	CF ₃	Me	CH ₂ Ph	N=CHOEt	
29-16	0	CF ₃	H	Me ₂ N	N=CHOEt	
29-17	1	CF ₃	H	Me ₂ N	N=CHOEt	135-136
29-18	2	CF ₃	H	Me ₂ N	N=CHOEt	
29-19	0	CF ₃	Et	EtNH	N=CHOEt	
29-20	1	CF ₃	Et	EtNH	N=CHOEt	(油状物) ¹⁹⁾
29-21	2	CF ₃	Et	EtNH	N=CHOEt	
29-22	0	CF ₃	H	OH	N=CHOEt	
29-23	1	CF ₃	H	OH	N=CHOEt	(油状物) ²⁰⁾
29-24	2	CF ₃	H	OH	N=CHOEt	
29-25	0	CF ₃	H	OMe	N=CHOEt	
29-26	1	CF ₃	H	OMe	N=CHOEt	(油状物) ²⁰⁾
29-27	2	CF ₃	H	OMe	N=CHOEt	

【0110】

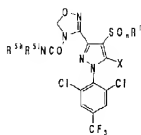
* * 【表66】



Comp.No.	n	R ¹	R ³	R ⁴	X	mp. (°C)
30-1	0	CF ₃	Me	OH	N=CHOEt	
30-2	1	CF ₃	Me	OH	N=CHOEt	(油状物) ²⁰⁾
30-3	2	CF ₃	Me	OH	N=CHOEt	
30-4	0	CF ₃	Me	OMe	N=CHOEt	
30-5	1	CF ₃	Me	OMe	N=CHOEt	131.5-132.5
30-6	2	CF ₃	Me	OMe	N=CHOEt	
30-7	0	CF ₃	Me		N=CHOEt	
30-8	1	CF ₃	Me		N=CHOEt	(7E/7Z) ²¹⁾
30-9	2	CF ₃	Me		N=CHOEt	
30-10	0	CF ₃	Et		N=CHOEt	
30-11	1	CF ₃	Et		N=CHOEt	86-88
30-12	2	CF ₃	Et		N=CHOEt	
30-13	0	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	
30-14	1	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	155-157
30-15	2	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	
30-16	0	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	
30-17	1	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	(7E/7Z) ²²⁾
30-18	2	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	
30-19	0	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	
30-20	1	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	97-99
30-21	2	CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	-	N=CHOEt	
30-22	0	CF ₃	-(CH ₂) ₄ NMe	-(CH ₂) ₄ -	N=CHOEt	
30-23	1	CF ₃	-(CH ₂) ₄ NMe	-(CH ₂) ₄ -	N=CHOEt	(7E/7Z) ²³⁾
30-24	2	CF ₃	-(CH ₂) ₄ NMe	-(CH ₂) ₄ -	N=CHOEt	
30-25	0	CF ₃	-(CH ₂) ₄ O	-(CH ₂) ₄ -	N=CHOEt	
30-26	1	CF ₃	-(CH ₂) ₄ O	-(CH ₂) ₄ -	N=CHOEt	(7E/7Z) ²⁴⁾
30-27	2	CF ₃	-(CH ₂) ₄ O	-(CH ₂) ₄ -	N=CHOEt	

[0111]

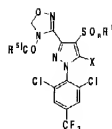
40【表67】



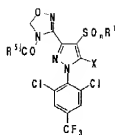
Comp.No.	n	R ¹	R ²	R ⁵	X	mp. (°C)
31-1	0	CF ₃	H		N=CHOEt	
31-2	1	CF ₃	H		N=CHOEt	179-180
31-3	2	CF ₃	H		N=CHOEt	
31-4	0	CF ₃	Me	Me	N=CHNMe ₂	
31-5	1	CF ₃	Me	Me	N=CHNMe ₂	174-175
31-6	2	CF ₃	Me	Me	N=CHNMe ₂	
31-7	0	CF ₃	Et	Et	N=CHNMe ₂	
31-8	1	CF ₃	Et	Et	N=CHNMe ₂	156-158
31-9	2	CF ₃	Et	Et	N=CHNMe ₂	

【0112】

* * 【表68】



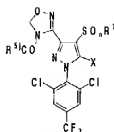
Comp.No.	n	R'	R''	X	mp. (°C)
32-1	0	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	94.0-94.5
32-2	1	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-3	2	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-4	0	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	92.5-93
32-5	1	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-6	2	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-7	0	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	73-74
32-8	1	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-9	2	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-10	0	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	(油状物) ²¹⁾
32-11	1	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-12	2	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-13	0	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	(油状物) ²⁰⁾
32-14	1	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-15	2	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	N = CHOEt	
32-16	0	CF ₃	Et ₂ CH	N = CHOEt	(油状物) ²²⁾
32-17	1	CF ₃	Et ₂ CH	N = CHOEt	
32-18	2	CF ₃	Et ₂ CH	N = CHOEt	
32-19	0	CF ₃	n-Pr ₂ CH	N = CHOEt	94-95
32-20	1	CF ₃	n-Pr ₂ CH	N = CHOEt	
32-21	2	CF ₃	n-Pr ₂ CH	N = CHOEt	
32-22	0	CF ₃	t-BuCH ₂	N = CHOEt	(7E/7Z) ²³⁾
32-23	1	CF ₃	t-BuCH ₂	N = CHOEt	
32-24	2	CF ₃	t-BuCH ₂	N = CHOEt	
32-25	0	CF ₃		N = CHOEt	125-126
32-26	1	CF ₃		N = CHOEt	
32-27	2	CF ₃		N = CHOEt	



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
33-1	0	CF ₃		N = CHOEt	
33-2	1	CF ₃		N = CHOEt	91-92
33-3	2	CF ₃		N = CHOEt	
33-4	0	CF ₃	-CH=CH-	N = CHOEt	
33-5	1	CF ₃	-CH=CH-	N = CHOEt	52-53
33-6	2	CF ₃	-CH=CH-	N = CHOEt	
33-7	0	CF ₃	-CH=CHMe	N = CHOEt	
33-8	1	CF ₃	-CH=CHMe	N = CHOEt	112-113
33-9	2	CF ₃	-CH=CHMe	N = CHOEt	
33-10	0	CF ₃	-CH=CHPh	N = CHOEt	
33-11	1	CF ₃	-CH=CHPh	N = CHOEt	(71-77) ¹⁰⁾
33-12	2	CF ₃	-CH=CHPh	N = CHOEt	
33-13	0	CF ₃	CH ₂ CHPh	N = CHOEt	
33-14	1	CF ₃	CH ₂ CHPh	N = CHOEt	115-116
33-15	2	CF ₃	CH ₂ CHPh	N = CHOEt	
33-16	0	CF ₃	CH ₂ OMe	N = CHOEt	
33-17	1	CF ₃	CH ₂ OMe	N = CHOEt	96-97
33-18	2	CF ₃	CH ₂ OMe	N = CHOEt	
33-19	0	CF ₃	CH ₂ CF ₃	N = CHOEt	
33-20	1	CF ₃	CH ₂ CF ₃	N = CHOEt	161-162
33-21	2	CF ₃	CH ₂ CF ₃	N = CHOEt	
33-23	0	CF ₃	H	N = CHOEt	
33-24	1	CF ₃	H	N = CHOEt	151-152
33-25	2	CF ₃	H	N = CHOEt	

【0114】

40【表70】



Comp.No.	n	R ¹	R ²	X	mp. (°C)
34-1	0	CF ₃	MeO	N = CHOEt	
34-2	1	CF ₃	MeO	N = CHOEt	(油状物) *
34-3	2	CF ₃	MeO	N = CHOEt	
34-4	0	CF ₃	EtO	N = CHOEt	
34-5	1	CF ₃	EtO	N = CHOEt	(油状物) *
34-6	2	CF ₃	EtO	N = CHOEt	
34-7	0	CF ₃	i-PrO	N = CHOEt	
34-8	1	CF ₃	i-PrO	N = CHOEt	(油状物) *
34-9	2	CF ₃	i-PrO	N = CHOEt	
34-10	0	CF ₃	t-BuO	N = CHOEt	102-103
34-11	1	CF ₃	t-BuO	N = CHOEt	(7モル分) *
34-12	2	CF ₃	t-BuO	N = CHOEt	(7モル分) *

【0115】本発明の化合物〔III〕の塩としては、農薬化学上許容可能な塩であればよい。すなわち、分子内にカルボキシ基、スルホ基などの酸性基を有している場合、塩基との塩を形成させてもよく、この塩基としては例えばナトリウム、カリウム、リチウム等のアルカリ金属、カルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類金属、アンモニアなどの無機塩基、例えばピリジン、コリジン、トリエチルアミン、トリエタノールアミンなどの有機塩基などが用いられる。また、分子内にアミノ基などの塩基性基を有している場合、酸との塩を形成させてもよく、この酸としては例えば塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、硫酸、過塩素酸等の無機酸の塩または、例えばギ酸、酢酸、酒石酸、リンゴ酸、クエン酸、シュウ酸、コハク酸、安息香酸、ピクリン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸の塩などが用いられる。また化合物〔III〕またはその塩を製造する場合もあり、その場合も本発明に含まれる。

【0116】本発明の化合物〔III〕またはその塩、および下記に示される化合物〔III〕またはその塩を製造する際の原料となる化合物〔IV〕は、WO97/28126に記載された方法もしくはそれに準じた方法により製造することができる。一般的には、原料となる化合物〔IV〕をアシル化剤またはアルキル化剤等と、所望により適当な酸または塩基触媒の存在下に反応させることにより化合物〔III〕またはその塩を合成することができ

*。かかる反応において用いられるアシル化剤としては、例えばカルボン酸ハライド（例、塩化アセチル、臭化プロピオン等）、カルバモイルハライド（例、塩化N,N-ジメチルカルバモイル、塩化N,N-ジエチルカルバモイル等）、ハロゲン炭酸エステル（例、クロル炭酸メチル、クロル炭酸フェニル等）、二炭酸ジアルキル（例、二炭酸ジtert-ブチル、二炭酸ジメチル等）、カルボン酸無水物（例、無水酢酸、無水プロピオン酸等）などの公知のアシル化剤を用いることができる。かかる反応において用いられるアルキル化剤としては、アルキルハライド（例、ヨウ化メチル、臭化エチル等）、アルキルスルホネート（例、メタンスルホン酸メチル、p-トルエンスルホン酸エチル、トリフルオロメタンスルホン酸メチル等）、硫酸ジアルキル（例、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸等）、オルトギ酸トリアルキル（例、オルトギ酸トリメチル、オルトギ酸トリエチル等）などの公知のアルキル化剤を用いることができる。本反応において、上記のアシル化剤あるいはアルキル化剤の量は特に限定されず、溶媒として大過剰量用いてもよい。本反応に用いられる塩基触媒としては、例えば、例えばナトリウムエチレート、ナトリウムメチレート、カリウムtert-ブトキシド等のアルカリ金属のアルコラート、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、N,N-ジメチルアニリン等の有機塩基、例えば炭酸カリウム、炭酸ナ

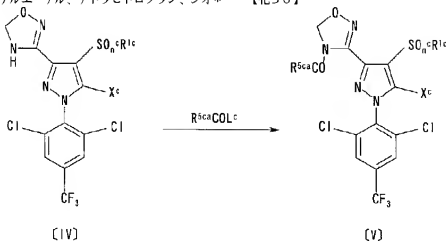
リウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基を用いることができる。用いる塩基の量は反応に悪影響を及ぼさない量であれば特に限定されず、溶媒を兼ねて大過剰量用いることもできるが、好ましくは0.1~2.0当量である。本反応に用いられる酸触媒としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、硫酸などの無機プロトン酸、例えば、乙酸、酢酸、酒石酸、リンゴ酸、クエン酸、シュウ酸、コハク酸、安息香酸、トリフルオロ酢酸、 p -トルエンスルホン酸などの有機プロトン酸、塩化アルミニウム、塩化第二鉄、塩化亜鉛、四塩化チタン、三フッ化ホウ素等のルイス酸などが用いられる。反応に用いられるかかる酸触媒の量は、反応に悪影響を及ぼさない量であれば特に限定されず、溶媒として大過剰量用いることもできるが、好ましくは0.1~2.0当量である。本反応は適当な溶媒を使用して行うことができる。かかる溶媒としては、反応基質、反応試薬および生成物と反応して副生成物を与えないものであれば特に限定されないが、反応基質および反応試薬の両者を溶解するものが望ましい。かかる溶媒としては、例えばベンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、乙酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラドロフラン、ジオ*

*キサン等のエーテル類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、スルホラン等のスルホン類、ヘキサメチルホスホルアミド等のリン酸アミド類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ヒリジン、ピコリン、ルチジン、キノリン等の芳香族アミン類、およびこれらの混合溶媒、水、さらにはこれらと水との混合溶媒が用いられる。

【0117】反応温度は、通常約-50~200℃であり、反応時間は一般には約0.1~96時間である。化合物(III)が遊離の化合物で得られる場合は、上記したような塩に、また塩の形で得られる場合は遊離の化合物に、それぞれ常法に従って変換することができる。また、化合物(III)に含まれる化合物が、他種の化合物(III)を製造する原料に用いられる時は、遊離のまま、または塩として用いてもよい。その他の原料が上記したような塩となりうる場合も同様に遊離のままのみならず塩として用いることができる。従って、下記の製造法に用いられる原料化合物および生成物については、その塩(例えば、上記化合物(III)で述べたような酸との塩等)も含めるものとする。化合物(III)またはその塩は具体的には以下のような方法によって製造することができる。

【0118】(反応式(A))

【化36】

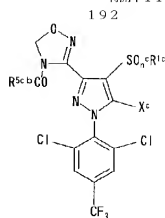
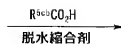
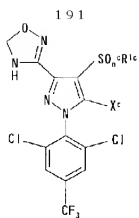


(IV)

(V)

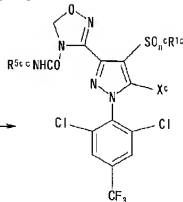
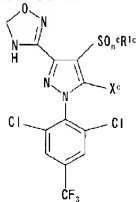
【0119】(反応式(B))

※ ※【化37】



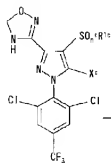
【0120】〔反応式 (C)〕

* * 【化38】

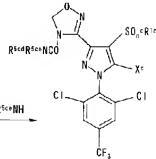
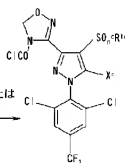


【0121】〔反応式 (D)〕

※30※【化39】

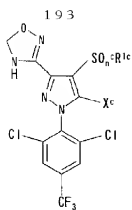


ホスゲンまたは
その等価体

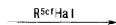


【0122】〔反応式 (E)〕

★ ★ 【化40】



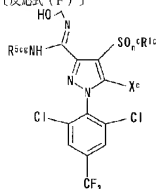
〔IV〕



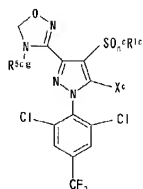
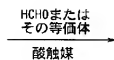
〔X〕

〔0123〕〔反応式(F)〕

* * 【化41】



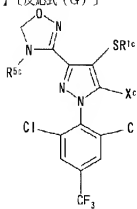
〔XI〕



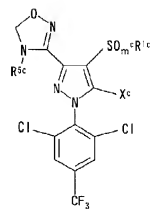
〔XII〕

〔0124〕〔反応式(G)〕

※ ※ 【化42】



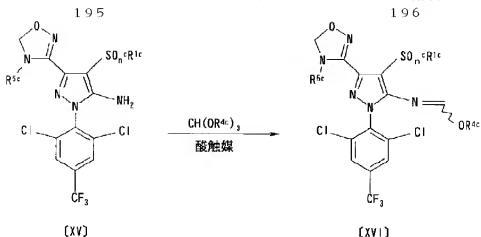
〔XIII〕



〔XIV〕

〔0125〕〔反応式(H)〕

★ ★ 【化43】



【0126】上記反応式(A)～(H)中、X^c、n^c、R^{1a}、R^{4c}およびR^{5a}は前記と同意義を、R^{5aa}は置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、置換されていてもよいC₃₋₉シクロアルキル基、置換されていてもよいC₂₋₆アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、C₁₋₆アルコキシ基、モノもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基を、R^{5ab}は置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、置換されていてもよいC₃₋₉シクロアルキル基、置換されていてもよいC₂₋₆アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基を、R^{5ac}、R^{5ad}、R^{5ae}は置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基を、m^cは1または2を、R^{5af}、R^{5ag}は水素原子、置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、置換されていてもよいC₃₋₉シクロアルキル基、置換されていてもよいC₂₋₆アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいC₂₋₆アルケニル基、置換されていてもよいC₂₋₆アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、モノもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基、環状アミノ基、ヒドロキシル基、C₁₋₆アルコキシ基を示すか、または結合する窒素原子とともに環状アミノ基を示す。R^{5aa}およびR^{5ab}における置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基のアルキル基としては例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、neo-ペンチル、1-エチルプロピル、1-アロピルブチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニルなどが挙げられる。該アルキル基の置換基としては前記R^{5c}で例示した置換されていてもよいアルキル基における置換基と同様のものが挙げられる。置換の数は、置換可能な範囲内で1ないし6、好ましくは1ないし3である。R^{5aa}、R^{5ad}、R^{5ae}、R^{5af}、R^{5ag}における置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基としては前記R^{5c}における置換されていてもよいアルキル基と同様のものが挙げられる。R^{5aa}、R^{5ab}、R^{5ad}、R^{5ae}のフェニル基の置換基としては前記R^{5c}におけるアシル基(アリールカルボニル基)の置換基と同様のものが挙げられる。置換基の数は1～5個(好ましくは1～3個)である。R^{5aa}、R^{5ad}、R^{5ae}におけるC₁₋₆アルコキシ基としてはメトキシ、エトキシ、プロポキシ、*50

*イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシなどが挙げられる。R^{5aa}、R^{5ad}、R^{5ae}のモノもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基におけるC₁₋₆アルキルとしては前記R^{5c}で例示したアルキル基と同様のものが挙げられる。R^{5aa}、R^{5ab}、R^{5ad}、R^{5ae}における置換されていてもよいC₃₋₉シクロアルキル基のシクロアルキル基としては例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどが挙げられる。R^{5aa}、R^{5ab}、R^{5ad}、R^{5ae}における置換されていてもよいC₂₋₆アルケニル基のアルケニル基としては例えばビニル、アリル、1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニルなどが挙げられる。R^{5ad}、R^{5ae}における置換されていてもよいC₂₋₆アルケニル基のアルケニル基としては例えばエチニル、1-プロピニル、プロパルギル、1-ブチニルなどが挙げられる。R^{5ad}、R^{5ae}における環状アミノ基としては例えば1-ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノ、4-メチル-1-ピペラジノなどが挙げられる。上記したようなシクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、環状アミノ基はヒドロキシル基、アミノ基、モノもしくはジ-C₁₋₆アルキルアミノ基(例、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等)、C₁₋₆アルコキシ基(例、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ等)、C₁₋₆アルキルチオ基(例、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ等)、ハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、フェニル基、カルボキシル基、ニトロ基およびシアノ基から選ばれる1～6(好ましくは1～3)個の置換基で置換されていてもよい。また、R^{5ad}、R^{5ae}が結合する窒素原子とともに示す環状アミノ基としては、例えば1-ピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノ、4-メチル-1-ピペラジノなどが挙げられる。

【0127】反応式(A)は、化合物(IV)をR^{5aa}COL^c[L^cはハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、アシルオキシ基(アセトキシ基、プロピオニルオキシ基、トリフルオロアセトキシ基などのハロゲン

で1〜3個置換されているよいC₁₂〜C₁₆アルキル・カルボニルオキシ基；メトキシカルボニルオキシ、セプトキシカルボニルオキシなどのC₁〜6アルコキシカルボニルオキシ基等のC₁〜16アルコキシ基等の脱離基を示す。〕で表されるアシル化剤と反応させて、化合物〔V〕を製造する反応を示す。化合物〔IV〕は本反応の原料となるのみでなく、それ自体優れた殺虫活性を有する。化合物〔IV〕の好ましい例としては、例えば1-（2，6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル）-5-エトキシメチレンアミノ-3-（Δ²-1，2，4-オキサジアゾリン-3-イル）-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール、1-（2，6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル）-3-（Δ²-1，2，4-オキサジアゾリン-3-イル）-5-（n-プロポキシメチレンアミノ）-4-トリフルオロメチルピラゾール、1-（2，6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル）-3-（Δ²-1，2，4-オキサジアゾリン-3-イル）-5-（n-プロポキシメチレンアミノ）-4-トリフルオロメチルフェニルピラゾールなどがあげられる。これらの化合物も本発明の方法に有利に用いることができる。本反応において、上記のアシル化剤の量は特に限定されず、溶媒として大過剰量用いてもよいが、好ましくは約0.8〜5当量である。反応を促進させ、かつ副生成物を少なくする目的で、塩基を共存させるかあるいは反応の前後に作用させることにより好結果が得られる場合がある。かかる塩基としては、例えば、例えばナトリウムエチレート、ナトリウムメチレート、カリウムtert-ブトキシド等のアルカリ金属のアルコレート、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、N,N-ジメチルアニリン等の有機塩基、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基を用いることができる。用いる塩基の量は反応に悪影響を及ぼさない量であれば特に限定されず、溶媒を兼ねて大過剰量用いることもできる。本反応は適当な溶媒を使用し行うことができる。かかる溶媒としては、反応基質、反応試薬および生成物と反応して副生成物を与えないものであれば特に限定されないが、反応基質および反応試薬の両者を溶解するものが望ましい。かかる溶媒としては、例えばベンゼン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、ギ酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、プロピニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミ

ド等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、スルホラン等のスルホ類、ヘキサメチルスルホランなどのリン酸アミド類、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2-ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン炭化水素類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、キノリン等の芳香族アミン類、およびこれらの混合溶媒、水、さらにはこれらと水との混合溶媒が用いられる。反応温度は、通常約-50〜200℃であり、好ましくは約-30〜150℃である。反応時間は一般に、より好ましくは約0.1〜24時間であり、好ましくは約0.1〜24時間である。得られた化合物はそれ自体公知の手段、例えば濃縮、減圧濃縮、液性変換、乾溶、溶媒抽出、蒸留、結晶化、再結晶、クロマトグラフィー等により分離、精製後、あるいは反応混合物のまま次の反応の原料に供されてもよい。

【0128】反応式（B）は、化合物〔IV〕をR⁵⁰⁰CO₂H〔R⁵⁰⁰は前記と同意義を示す。〕で表されるカルボン酸誘導体と、脱水縮合剤の共存下で反応させて、化合物〔VI〕を製造する反応を示す。本反応に用いられる脱水縮合剤としては、DCC（ジシクロヘキシルカルボジイミド）、カルボニルジイミダゼール、BOP試薬（ペンゾトリアゾール-1-イルオキシトリリス（ジメチルアミノ）ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート）等の公知の脱水縮合剤が用いられる。用いる量は特に限定されないが、好ましくは0.8〜5当量である。本反応に用いるカルボン酸誘導体の量は特に限定されず、溶媒として大過剰量用いることもできるが、通常約0.8〜5当量である。

【0129】反応式（C）は化合物〔IV〕をR⁵⁰⁰NCOR⁵⁰⁰〔R⁵⁰⁰は前記と同意義を示す。〕で表されるイソシアネート誘導体と反応させて、化合物〔VII〕を製造する反応を示す。本反応に用いるイソシアネート誘導体の量は特に限定されず、溶媒として大過剰量用いてもよいが、好ましくは約0.8〜5当量である。反応を促進させ、かつ副生成物を少なくする目的で、塩基を共存させるかあるいは反応の前後に作用させることにより好結果が得られる場合がある。かかる塩基の種類と使用量は、反応式（A）と同様である。

【0130】反応式（D）は化合物〔IV〕をホスゲンまたはその等価体と反応させて、中間体〔VIII〕とし、これにR⁵⁰⁰R⁵⁰⁰NH〔R⁵⁰⁰は前記と同意義を示す。〕で表されるアミン類を反応させて、化合物〔IX〕を製造する反応を示す。本反応に用いられるホスゲンまたはその等価体としては、ホスゲン、トリクロロメチルクロロホルム（ジホスゲン）、ビストリクロロメチルカルボネート（トリホスゲン）等が用いられる。用いる量は特に限定されないが、好ましくは0.3〜5当量である。中間体〔VIII〕はそれ自体公知の手段、例えば濃縮、減圧濃縮、液性変換、乾溶、溶媒抽出、蒸留、結晶化、再結晶、クロマトグラフィー等により分離、精製

後、あるいは反応混合物のまま次の反応の原料に供されてもよい。本反応に用いられる $R^{200}R^{201}NH$ で表されるアミン類の量は特に限定されず、溶媒として大過剰量を用いることもできるが、通常約0.8〜5当量である。

【0131】反応式(E)は化合物(IV)を $R^{202}H$ 【式中、 R^{202} は前記と同意義を、 H はハロゲン原子(例、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)を示す。】で表されるアルキルハライド類と反応させて、化合物(X)を製造する反応を示す。本反応に用いられる $R^{202}H$ で表されるアルキルハライド類の量は特に限定されず、溶媒として大過剰量を用いることもできるが、通常約0.8〜5当量である。反応を促進させ、かつ副生成物を少なくする目的で、塩基を共存させるかあるいは反応の前後に作用させることにより好結果が得られる場合がある。かかる塩基の種類と使用量は、反応式(A)と同様である。

【0132】反応式(F)は化合物(XI)をホルムアルデヒドまたはその等価物と反応させて、化合物(XII)を製造する反応を示す。本反応に用いられるホルムアルデヒドまたはその等価物としては、ホルムアルデヒド、パラホルムアルデヒド等が用いられる。用いる量は特に限定されず、溶媒として大過剰量を用いることもできるが、好ましくは0.8〜1.5当量である。反応を促進させ、かつ副生成物を少なくする目的で、酸を共存させるかあるいは反応の前後に作用させることにより好結果が得られる場合がある。かかる酸触媒としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、硫酸などの無機プロトン酸、例えば、ギ酸、酢酸、酒石酸、リンゴ酸、クエン酸、シュウ酸、コハク酸、安息香酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンсульホン酸などの有機プロトン酸、塩化アルミニウム、塩化第二鉄、塩化亜鉛、四塩化チタン、三フッ化ホウ素等のルイス酸などが用いられる。反応に用いられるかかる酸触媒の量は、反応に悪影響を及ぼさない量であれば特に限定されず、溶媒として大過剰量を用いることもできる。

【0133】反応式(G)は化合物(XIII)を酸化剤により酸化して、化合物(XIV)を製造する反応を示す。本反応に用いられる酸化剤としては、例えば過酸化水素、過酢酸、過安息香酸、m-クロロ過安息香酸、メタ過ヨウ素酸ナトリウム、オゾン、二酸化セレン、クロム酸、臭素、n-プロピルモリブデン酸イミド、ヨードシベンゼン、次亜塩素酸ナトリウムなどの酸化剤が用いられる。用いる量は特に限定されず、溶媒として大過剰量を用いることもできるが、好ましくは0.8〜5当量である。

【0134】反応式(H)は化合物(XV)を $CH(OR^{203})_2$ で表わされるオルトギ酸トリアルキルエステルと反応させ、化合物(XVI)を製造する反応を示す。本反応に用いられるオルトギ酸トリアルキルエステルの量は特に限定されず、溶媒として大過剰量を用いることもでき

るが、好ましくは0.8〜1.5当量である。反応を促進させ、かつ副生成物を少なくする目的で、酸を共存させるかあるいは反応の前後に作用させることにより好結果が得られる場合がある。かかる酸触媒としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、硫酸などの無機プロトン酸、例えば、ギ酸、酢酸、酒石酸、リンゴ酸、クエン酸、シュウ酸、コハク酸、安息香酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンсульホン酸などの有機プロトン酸、塩化アルミニウム、塩化第二鉄、塩化亜鉛、四塩化チタン、三フッ化ホウ素等のルイス酸などが用いられる。反応に用いられるかかる酸触媒の量は、反応に悪影響を及ぼさない量であれば特に限定されず、溶媒として大過剰量を用いることもできる。

【0135】反応式(B)〜(H)の各反応は適当な溶媒を使用して行うこともできる。かかる溶媒としては、反応式(A)において上記したものと同様のものが用いられる。反応式(B)〜(H)の各反応に用いられる温度は、通常約−50〜200℃であり、好ましくは約−30〜150℃である。反応時間一般には約0.1〜96時間、好ましくは約0.1〜72時間、より好ましくは約0.1〜24時間である。反応式(B)〜(H)の各反応で得られた化合物は、反応式(A)で記載したそれ自体公知の手段により分離、精製後、あるいは反応混合物のまま次の反応の原料に供されてもよい。上記した化合物(I)、(II)および(III)またはその塩を含有する農薬組成物は、優れた殺虫活性を有し、毒性が極めて少なく安全で、優れた農薬組成物(殺虫剤)として用いることができる。

【0136】

【発明の実施の形態】衛生害虫、植物寄生昆虫の防除に有効な農薬活性成分を使用するにあたっては、一般の農薬の取り得る形態、一種または二種以上の農薬活性成分をそれ自体で、あるいは適当な液体の担体に溶解させるか分散させ、または適当な固体担体と混合させるか吸着させ、乳剤、液剤、マイクロナエマルジョン、フロアブル剤、油剤、水溶液、水和剤、粉剤、粒剤、微粒剤、マイクロナエマル剤等の剤型の組成物として使用する。これらの製剤は必要ならば例えば乳化剤、懸濁剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤、粘着剤、安定剤等を添加してもよく、自体公知の方法で調製することができる。

【0137】使用する液体担体(溶剤)としては、例えば水、アルコール類(例えばメチルアルコール、エチルアルコール、n-プロピルアルコール、イソプロピルアルコール、エチレングリコール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン等)、エーテル類(例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル等)、脂肪族炭化水素類(例えばプロパン、灯油、燃料油、機械油等)、芳香族炭化水素類(例えばベンゼン、

201

トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、メチルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロメタン、クロホルム、四塩化炭素等)、酸アミド類(例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等)、エステル類(例えば酢酸エチル、酢酸ブチル、脂肪酸グリセリンエステル等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル、アロビオニトリル等)等の溶媒が適当であり、これらは一種または二種以上を適当な割合で混合して適宜使用することができ、固体担体(希釈・増量剤)としては、植物性粉末(例えば大豆粉、タバコ粉、小麦粉、木粉等)、鉱物性粉末(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等のクレイ類、滑石粉、ロウ石粉等のタルク類、珪藻土、雲母粉等のシリカ類等)、アルミナ、硫黄粉末、活性炭等が用いられ、これらは一種または二種以上を適当な割合で混合して適宜使用することができる。

【0138】乳化剤、展着剤、浸透剤、分散剤等として使用される界面活性剤としては、必要に応じて石鹸類、ポリオキシエチレンアルキルアールエーテル類(例、ノイゲン(商品名)、イー・エー142(E-A142(商品名))；第一工業製薬(株)製、ノール(商品名))；東邦化学(株)製)、アルキル硫酸塩類(例、エマル10(商品名)、エマル40(商品名)；花王(株)製)、アルキルスルホン硫酸塩類(例、ネオゲン(商品名)、ネオゲンT(商品名))；第二工業製薬(株)製、ネオペレックス；花王(株)製)、アルキルスルホハク酸エステル塩類(例、ニューカルグEP-60P(竹本油脂(株)製))、ポリエチレングリコールエーテル類(例、ノニボール85(商品名)、ノニボール100(商品名)、ノニボール160(商品名))；三洋化成(株)製)、多価アルコールエステル類(例、トウイン20(商品名)、トウイン80(商品名)；花王(株)製)等の非イオン系およびアニオン系界面活性剤が適宜用いられる。さらに、上記製剤が必要に応じてカルボキシメチルセルロースのナトリウム塩(例、セロゲン6A、セロゲン7A(第一工業製薬(株)))やデキストリン(例、デキストリンND-5(日濃化学(株)))などの結着剤を加えてもよい。また、化合物【I】、【II】、【III】またはその塩と、例えば他種の殺虫剤(ピレスロイド系殺虫剤、有機リン系殺虫剤、カルバメート系殺虫剤、ネオニコチノイド系殺虫剤、天然殺虫剤等)、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物ホルモン剤、植物成長調節物質、殺菌剤(例えば銅系殺菌剤、有機塩素系殺菌剤、有機硫黄系殺菌剤、フェニール系殺菌剤など)、共力剤、誘引剤、忌避剤、色素、肥料等とを配合し、適宜使用することも可能である。

【0139】農業活性成分を組成物として使用する場合、組成物における農業活性成分の含有割合は農業活性成分の種類にもよるが、通常約0.1~80重量%、好ましくは約0.5~20重量%である。たとえば農業活

202

性成分として化合物【I】、【II】、【III】またはその塩を用いる場合、組成物における化合物【I】、【I1】、【II1】またはその塩の含有割合は、組成物全量に対して、通常約0.1~80重量%、好ましくは約0.5~20重量%程度である。具体的には、乳剤、液剤、水溶液、水和剤などを用いる場合は、通常約0.1~80重量%程度、好ましくは約1~50重量%程度が適当である。油剤、粉剤などを用いる場合は、通常約0.1~50重量%程度、好ましくは約0.1~20重量%程度が適当である。粒剤などを用いる場合は、通常約5~50重量%程度、好ましくは約1~20重量%程度が適当である。後述の化合物【I】、【II】、【III】またはその塩以外に配合し得る他の農業活性成分(例、殺虫剤、除草剤、殺ダニ剤および(または)殺菌剤)は製剤全量に対して、通常約1~80重量%程度、好ましくは約1~20重量%程度の範囲で使用される。上記有効成分以外の添加剤の含量は、農業活性成分の種類または含量、あるいは製剤の剤形などによって異なるが、通常約0.001~99.9重量%程度、好ましくは約1~99.9重量%程度である。より具体的には、組成物全量に対して、界面活性剤を通常約1~20重量%程度、好ましくは約1~15重量%、流動助剤を約1~20重量%程度、担体を約1~90重量%、好ましくは約1~70重量%を添加するのが好ましい。具体的には、液剤を製造する場合は、界面活性剤を通常約1~20重量%程度、好ましくは1~10重量%程度と、水を約20~90重量%添加するのが好ましい。乳剤、水溶液、水和剤などは使用に際して、水などで適宜希釈増量(例えば、約100~5,000倍)して用いるのがよい。

【0140】本発明の化合物【I】、【II】、【III】またはその塩と混合して使用できる殺虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤の代表例を以下に示す。E P N (EPN)、アセフエート(acephate)、イソキサチオン(isoxathion)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロカルブ(isoprocabarb)、エトリムホス(etrimfos)、オキシデプロホス(oxydeprofos)、キナルホス(quinalphos)、キャドサホス(cadusafos)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クロロフェンビンホス(chlorofenvinphos)、サリチオン(salithion)、シアノホス(cyanophos)、ジスルトン(disulfoton)、ジメトエート(dimethoate)、スルプロホス(sulprofos)、ダイアジノン(diazinon)、チオメトン(thiometon)、テトラクロルピリホス(tetrachlorvinphos)、テバピリムホス(tebupirifos)、トリクロルホン(trichlorphon)、ネアルド(naled)、パミドチオン(vamidithion)、ピラクロホス(pyraclorhos)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、ピリミホス-メチル(pirimiphos-methyl)、フェニトクロチオン(fenitrothion)、フェンチオン(fenthion)、フェ

203

ントエート (phenothate)、フォスチアゼート (fosthi azate)、ブタチオホス (butathiofos)、プロチオホス (prothiofos)、プロバホス (propaphos)、プロフェノホス (profenofos)、ホサロン (phosalone)、ホスチアゼート (fosthi azate)、マラソン (malathion)、メチダチオン (methidathion)、メトルカルブ (metolcarb)、モノクロトホス (monocrotophos)、BPMC (BPMC)、XMC (XMC)、アラニカルブ (alanycarb)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、カルバリル (carbaryl)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルボフラン (carbofuran)、キシリカルブ (xylylc arb)、クロエトカルブ (cloethcarb)、チオジカルブ (thiodicarb)、トリアゼメイト (triazamate)、ピリミカーブ (pirimicarb)、フェノキシカーブ (fenoxycarb)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フラチオカルブ (furathiocarb)、プロポカルブ (propoxur)、ベンダイオカルブ (bendiocarb)、ベンラカルブ (benfuracarb)、メソミル (methomyl)、アクリナトリン (acrinathrin)、イミプロトリン (imiprothrin)、エトフェンプロックス (ethofenprox)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、シグマサイパーメスリン (sigmacypermethrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、シフルトリン (cyfluthrin)、シベルメトリン (cypermethrin)、シラフルオフェン (silaflofen)、テフルトリン (tefluthrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、【0141】トラロメトリン (tralomethrin)、フェンバレーテ (fenvalerate)、フェンプロバトリン (fenprophathrin)、フルシシネート (flucythrinate)、フルバリネート (fluvalinate)、フルフェンプロックス (flufenoprox)、フルプロキシフェン (fluproxyfen)、フルメスリン (flumethrin)、アラレトリン (prallethrin)、ベータシフルトリン (beta-cyfluthrin)、ベンフルスリン (benfluthrin)、ベルメトリン (permethrin)、アセタミプリド (acetamiprid)、イミダクロプリド (imidacloprid)、カルタップ (cartap)、チオシクロム (thiocyclam)、ニテンピラム (nitenpyram)、ベンスルタップ (bensultap)、アベルメクタン (avermectin)、エマメクタンベンゾエート (emamectin-benzoate)、クロフェンテジン (clofentezin)、クロフルアズロン (chlorfluazuron)、シロマジン (cyromazine)、ジアフエンチアロン (difenthiuron)、ジエノクロル (dienochlor)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、スピノシン (spinosyn)、スルフラミド (sulfuramid)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、テプフェノジド (tebufenozide)、テプフェンピラド (tebufenpyrad)、ハイドロアレ (hydroprene)、バニリアール (vaniliprole)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリダベン (pyridaben)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、ピリミディフェン (pyrimidifen)、フィプロニ

204

ル (fipronil)、フェナザキン (fenazaquin)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フルアズロン (fluazuron)、フルシクロクソロン (flucycloxuron)、フルフェノクソロン (flufenoxuron)、ブプロフェジン (buprofezin)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、ミルベマイシン (milbemycin)、メトキサジアゾン (metoxadiazon)、ルフェヌロン (lufenuron)、レバミズール (levamisol)、クロルフェナピル (chlorfenvapir)、NC-184 (NC-184)、YI-5301 (YI-5301)、【0142】IBP (IBP)、アムプロビルホス (ampropylfos)、エジファエンホス (edimphos)、クロルチオホス (chlorthiofos)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、ホセチル (fosetyl)、イプコナゾール (ipconazole)、イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、エタコナゾール (elacconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、トリアジメノール (tridimenol)、トリアジメホス (tridimofon)、トリチコナゾール (triticonazole)、トリフォリン (triforine)、ビテルタノール (biteranol)、ビニコナゾール (viniconazole)、フェナリモル (fenarimol)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フルオトリマゾール (floutriazazole)、フルコナゾールシス (furoconazole-cis)、フルシラゾール (flusilazole)、フルトリアホル (flutriafol)、ブロムコナゾール (bromconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ミクロブタニル (myclobutanil)、メトコナゾール (metconazole)、カルベンダジン (carbendazim)、デバカルブ (decarb)、プロチオカーブ (prothiocarb)、ベノミル (benomyl)、マネブ (maneb)、TPN (IPN)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イプロジオン (iprodion)、イミノクタジン (iminocladine-albesil)、イミノクタジン酢酸塩 (iminocladine-triacetate)、エチリモル (ethirimol)、エトリジアゾール (etridiazol)、オキシサジキシル (oxadixyl)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、オフレース (ofurace)、カスガマイシン (kasugamycin)、カルボキシ (carboxin)、キヤフタン (capytan)、クロジラコン (clozylacon)、クロベンチアゾン (chlorbenthiazole)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフロラン (cyprofluran)、ディエフエンカルブ (diethofencarb)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、【0143】ジクロメジン (diclomezine)、ジネブ (z

ineh)、ジメチリモル(dimethirimol)、ジメトモルフ(dimethomorph)、ジメフルアゾール(dimethiazol e)、チオペンダゾール(thiabendazole)、チオフェネートメチル(thiophanate-methyl)、チフルザミド(thifluzamide)、テクロフタラム(tecloftalam)、トリアゾキシド(triazoxide)、トリクラミド(triclamide)、トリシクラゾール(tricyclazole)、トリデモルフ(tridemorph)、トリフルミゾール(trifluthiazol e)、バリグマイシンA(バリアミジン A)、ヒメキサゾール(hymexazol)、ピラカルボリド(pyrcarboli d)、ピラゾホス(pyrazophos)、ピリフェノックス(pyriphenox)、ピリメタニル(pyrimethanil)、ピロキロン(pyroquilon)、フェリムゾン(ferimzone)、フェンピクロニル(fenpiclonil)、フェンプロピジン(fenpropidin)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、フラサイド(fthalid)、フラメトビル(furametpyr)、フララキシル(furalaxyl)、フルアジナム(fluzinam)、フルカルバニル(furcarbani l)、フルキンコナゾール(flquinconazole)、フルジオクソニル(flu dioxonil)、フルスルファミド(flusulfamid)、フルトラニル(flutolanil)、ブチオベート(butiobat e)、プロクロラズ(prochloraz)、プロシミドン(pro cymidone)、プロベナゾール(probenazole)、ベナラキシル(benalexyl)、ベノダニル(benodanil)、ペンシクロン(pencycuron)、ミクロゾリン(myclozolin)、メタラキシル(metalaxyl)、メトスルホバックス(metsulfosax)、メトフルキサム(methfuroxan)、メバニピリム(mepanipyrim)、メプロニル(mepro n i l)、BAS-490F(kresoxim)、アゾキシストロビン(azoxystrobin)、SSF-126(SSF-126)、カルパロバミド(carpropamid)

【0144】農薬活性成分としては、例えばナガメ(Eur ydema rugosum)、ホソヘリカメムシ(Riptortus clavatu s)、ナシゲンバイ(Stephanitis nashi)、ダイズアブラムシ(Aphis glycines)、ニセダイコンアブラムシ(Lipap his erysimi)、ダイコンアブラムシ(Brevicorynebrassi cae)、ワタアブラムシ(Aphis gossypii)、モモアカアブラムシ(Myzus persicae)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ(Aulacorthum solani)、タバココナジラミ(Bemisia t abaci)、オンシツコナジラミ(Trialeurodes vaporarior um)、セジロウコン(Sogatella furcifera)、チャバネアオカメムシ(Plautia stali)等の半翅目害虫、例えばハスモンヨトウ(Spodoptera litura)、コナガ(Plutella x ylostella)、モンシロチョウ(Pieris rapae crucivor a)、タマナギンウツバ(Autographa nigrisigna)、タバコガ(Helicoverpa assulta)、アワヨトウ(Pseudaletia separata)、ヨトウガ(Mamestra brassicae)、ワノメイガ(Notarcha derogata)、ジャガイモガ(Phthorimaea percullella)、シロイチモジヨトウ(Spodoptera exigu a)、カブラヤガ(Agrotiis segetum)、タマナヤガ(Agroti

sipisilon)、オオタバコガ(Heliothis armigera)、タバコバッドワーム(Heliothis virescens)、ボールワーム(Heliothis zea)、ヨロビアンコーンボーラー(Ostrin ia nubilalis)、アワノメイガ(Ostrinia furnacalis)、イネツトムシ(Parnara guttata)等の鱗翅目害虫、例えばニジュウヤホシテントウ(Epilachna vigintioctopunc tata)、ウリハムシ(Aulacophora femoralis)、キスジノミハムシ(Phyllotreta striolata)、ワタシロムシ(An thonus grandis)、アズキゾウムシ(Callosobruchus c hinensis)、マメコガネ(Popillia japonica)、ドウガネブイブイ(Anomala cuprea)、コンフルートワームの仲間(Diabrotica spp.)、コロラドハムシ(Leptinotarsa dec emlineata)、コマツキムシの仲間(Agriotes spp.)、タバコシバナムシ(Lasioderma serricornis)、ヒメマルカツオブシムシ(Anthrenus verbasci)、コクヌストモドキ(Tribolium castaneum)、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)等の甲虫目害虫、例えばタマネギバエ(Delia ant ica)、タネバエ(Delia platura)、マメハモグリバエ(L irionyma trifolii)、ナスハモグリバエ(Lirionyma bry oniae)等の双翅目害虫、例えばトサマバク(Locusta migratoria)、ケラ(Gryllotalpa africana)等の直翅目害虫、例えばネギアザミウマ(Thrips tabaci)、ミナミキイロアザミウマ(Thrips parvi)、ミカンキイロアザミウマ(Frankliniella occidentalis)等の総翅目害虫、例えばブラハバ(Thalia rosea)等の膜翅目害虫、例えばナミハダニ(Tetranychus urticae)、ミカンハダニ(Pa nonychus citri)、カンザウハダニ(Tetranychus kanzawa i)、ニセナミハダニ(Tetranychus cinnabarinus)、リンゴハダニ(Panonychus ulmi)、ミカンサビダニ(Aculop s pelekassi)、チャノホコリダニ(Polyphagotarsonemus latus)、ネダニ(Rhizoglyphus echinopus)等のダニ目害虫、例えばサツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incognita)、キタネダラセンチュウ(Pratylenchus p enetrans)、イチゴメセンチュウ(Nothotylenchus acris)等の線虫類などの防除に有効なものが用いられる。化合物【I】、【II】、【III】またはその塩は、上記した害虫の中でも特にワタアブラムシ、モモアカアブラムシなどのアブラムシ類、タバココナジラミ、オンシツコナジラミなどのコナジラミ類、ミナミキイロアザミウマなどのアザミウマ類、マメハモグリバエなどのハモグリバエ類、コナガ、モンシロチョウなどの鱗翅類に対して有効である。

【0145】処理量は対象作物の種類、育苗用容器(例、箱、育苗ポット、トレイ、鉢、プランター)のサイズ、防除対象とする害虫の種類によって、適宜変更することができるが、一般的には農薬活性成分を有効成分量で0.005g〜1.0g/リットル、好ましくは0.02〜0.5g/リットルの割合で播種あるいは移植前に土壌と混和し、農薬活性成分が混和された土壌を育苗用培土として使用すればよい。農薬活性成分はそのまま、あるいは組

207

成物として土壌と混和できるが、水和剤、水溶剤、乳剤をさらに水で希釈して溶液状態で土壌と混和してもよい。農業活性成分、あるいはその組成物と土壌との混和は薬剤と育苗用培土が均一になるようにミキサーなどの混合機を用いたり、あるいは手動で混合せねばならない。薬剤の混和対象となる育苗用培土として用いる土壌は、保水性、排水性および通気性がよく、作物の苗を育てるのに適した土壌であれば使用できる。具体的には、全農のプラグ苗専用育苗培土と、セル成型苗専用育苗一番、げんきくんセル100またはニッピ良菜培土、株式会社クボタのクボタセル成型育苗土、クイイ種苗株式会社、マザーソイルまたはサンサン床土、スミリン農産工業株式会社、土太郎などの市販の培土や山土などを使用することができるが、上記したような土壌に限定するものではない。このような土壌には必要に応じて肥料（例、化学肥料、腐葉土、牛糞、鶏糞、豚糞等）、保水性改良材（例、ビートモス、腐葉土、パーミキュライト等）や肥効改良剤（例、ゼオライト）などを混和してもよい。また、育苗する作物の種類に応じて適したpHに調節するために、さらに石灰あるいはイオウなどのpH調節剤を混和してもよい。播種は通常の方法で行えばよく、例えば上記の育苗用培土を約50〜約800個の小型ポットが連続して形成されているセルトレーまたはプラグトレーと呼ばれる約28cm×約54cmの大きさの樹脂製トレーまたは直径約4cm〜約15cmのポリ鉢などの育苗用容器に充填し、1ポット当たり1〜数粒の作物種子を撒き、覆土後に灌水すればよい。作物の育苗においては育苗期間中に、より大きなポットに植え替えをし、さらに育苗を継続してもよい。このような大きなポットへの植え替え、すなわち仮植の時には該仮植前に上記の薬剤を育苗用培土に混和し、該薬剤が混和された育苗用培土を用いて育苗することもできる。育苗は農家にとって重要な作業であり、苗の良否がその後の作物生育の良否を決定するといっても過言ではない。そのため農家は播種時から苗を圃場に植え付ける（定植）までの育苗をビニールハウスなどの施設内で多くの時間をかけて、病害虫管理、水管理、温度管理、肥培管理など注意深く行う場合が多い。本発明の方法では、育苗は施設内あるいは露地など育苗に適したいかなる場所でも適用できる。育苗期間は対象作物にもよるが、一般的に1週間から3ヶ月である。育苗に適した温度は対象作物にもよるが、一般的に約0℃から約50℃、好ましくは約10℃〜約30℃である。本発明の方法によれば、育苗業者のように、育苗期間中だけの害虫防除を必要とする場合でも、少量の農業活性成分を一回処理するだけで育苗期間中の散布を省略でき、経済性に優れている。更に、本発明によって定植薬剤処理作業と定植作業を分離でき、多忙な定植時を避けて、農閑期の作業として土壌に薬剤を混和しておくことができる。混和後使用するまでの期間は、土壌の種類、湿度等によって異なるが、乾燥状態の土壌で

208

は、使用する一ヶ月以上前の農家にとって都合のよい時に混和しておけばよい。また、育苗用培土には通常、上記したような肥料、pH調節剤、保水性改良材などの資材が混和されるが、薬剤はこれらと同時に土壌に混和でき、本発明における薬剤処理に要する労力はごく小さいものである。また、育苗用培土による薬剤の持ち込みによって害虫を防除するので、作物の苗を圃場（例、ビニールハウスなどの施設、露地など）に植え付ける定植作業は、手動でも従来型の機械（例、移植機）を利用してよい。

【0146】本発明の対象となる作物は、ビニールポット、セルトレーなどの育苗用容器を用いて育苗後、本圃に定植するイネ以外の被子植物（例、ケシ目、アカザ目、バラ目、セリ目、ツバキ目またはアオイ目植物などの離弁花植物やシソ目、ウリ目、キョウ目、イソマツ目、モクセイ目またはサクラソウ科植物などの合弁花植物などの双子葉植物、ユリ目、イネ目（但し、イネを除く）植物などの単子葉植物）である。ケシ目植物としてはハクサイ、キャベツ、カリフラワー、ブロッコリー、ストックなどのアブラナ科植物が挙げられる。アカザ目植物としてはホウレンソウなどのアカザ科植物やカーネーションなどのカデシコ科植物が挙げられる。バラ目植物としてはサヤエンドウ、エダマメ、サヤインゲンなどのマメ科植物やイチゴなどのバラ科植物が挙げられる。セリ目植物としてはバセリ、セリ目などのセリ科植物が挙げられる。ツバキ目植物としてはパンジーなどのスミレ科植物が挙げられる。アオイ目植物としてはオウゴンなどのアオイ科植物が挙げられる。シソ目植物としてはナス、トマト、タバコ、ピーマンなどのナス科植物やサルビアなどのシソ科植物が挙げられる。ウリ目植物としてはキュウリ、カボチャ、スイカ、メロンなどのウリ科植物が挙げられる。キョウ目植物としてはレタス、シュンギク、キク、マリーゴールドなどのキク科植物が挙げられる。イソマツ目植物としてはスターチスなどのイソマツ科植物が挙げられる。モクセイ目植物としてはトコギョウなどのリンドウ科植物が挙げられる。サクラソウ目植物としてはシクラメンなどのサクラソウ科植物が挙げられる。ユリ目植物としてはネギ、タマネギなどのユリ科植物が挙げられる。イネ目植物としてはスイートコーンなどのイネ科植物が挙げられる。作物の栽培手順のフローチャート（図1）に示す。

【0147】

【実施例】以下に、参考例および試験例を示して本発明さらに具体的に説明するが、本発明はこれらに限定されるべきものではない。参考例のカラムクロマトグラフィーにおける溶出で、TLC（Thin Layer Chromatography、薄層クロマトグラフィー）による観察下に行われた。TLC観察においては、TLCプレートとしてメルク（Merck）社製のキーゼルゲル60F254（70〜230メッシュ）を、展開溶媒としてはカラムクロマト

グラフィーで溶出溶媒として用いた溶媒を、検出法としてUV検出器を採用した。カラム用シリカゲルは同じくメルク社製のキーゼルゲル60(70-230メッシュ)を用いた。NMRスペクトルはプロトンNMRを示し、内部基準としてテトラメチルシランを用いて、ブルカーAC-200P(200MHz)型スペクトロメーターで測定し、全 δ 値をppmで示した。展開溶媒として混合溶媒を用いる場合に(1)内に示した数値は各溶媒の容量混合比である。なお、本願明細書中略号は、次のような意義を有する。Me:メチル基、Et:エチル基、Ph:フェニル基、Pr-n(もしくはn-Pr):n-プロピル、Pr-i(もしくはi-Pr):イソプロピル、Bu-n(もしくはn-Bu):n-ブチル、Bu-i(もしくはi-Bu):イソブチル、Bu-s(もしくはs-Bu):sec-ブチル、Bu-t(もしくはt-Bu):tert-ブチル、s:シングレット、br:ブロード(幅広い)、brs:ブロードシングレット(幅広いシングレット)、d:ダブルット、t:トリプレット、q:クワレット、qu:クインテット(5重線)、m:マルチプレット、dd:ダブルダブルット、dt:ダブルトリプレット、J:カップリング定数、Hz:ヘルツ、%:重量%、mp:融点、また室温とあるのは約15~25℃を意味する。

【0148】

【参考例1】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール31.6g(65.4mmol)をオルトギ酸トリエチル315ml(1.89mmol)に溶解し、p-トルエンサルホン酸一水和物1.25g(6.54mmol)を加え、40℃で4時間攪拌した。反応後、減圧下でオルトギ酸トリエチルを留去し、残渣にn-ヘキサンおよび少量のクロロホルムを加えてよくこすり、生じた結晶をろ取、乾燥し、7.94g(14.8mmol)の1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを無色結晶として得た。母液を濃縮後、アセトニトリル200ml、水50mlを加え、1.2規定塩酸0.5mlを加え、室温で30分静置した。減圧濃縮後、n-ヘキサン/アセトン混合溶媒を加えてよくこすり、生じた結晶をろ取、乾燥し、さらに21.1g(39.2mmol)の1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを得た。

収率 82%。

mp. 186~187℃

NMR(CDCl₃, δ) 1.20 (3H, t, J=7Hz), 4.08 (2H, m), 5.21 (1H, br), 5.44 (1H, s), 5.49 (1H, s), 7.75 (1H, s), 7.76 (1H, s), 8.50 (1H, br)

【0149】同様の方法を用いて、以下の化合物を合成した。1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-(n-プロボキシメチレンアミノ)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールmp. 106~107℃

【0150】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-(n-プロボキシメチレンアミノ)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールmp. 111~112℃

【0151】

【参考例2】5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(N¹-エチル-N²-ヒドロキシアミジノ)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール10.1g(20.5mmol)を100mlのTHFに溶解し、塩化亜鉛5.58g(40.9mmol)、水素化ホウ素ナトリウム1.76g(41.9mmol)を加えた。室温で5日間攪拌し、反応混合物を水150mlに注入した。酢酸エチル100mlを加え、生成した沈殿物をセライトを用いてろ過した。母液を飽和食塩水100mlで2回洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去すると、黄褐色アモルファスが得られた。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)、6.45g(13.0mmol)の5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(N¹-エチル-N²-ヒドロキシアミジノ)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを淡黄色アモルファスとして得た。

収率 63%。

NMR(CDCl₃, δ) 1.15 (3H, t, J=7Hz), 3.47-3.62 (2H, m), 5.07 (1H, t, J=6.3Hz), 5.14 (2H, br), 7.24 (1H, br), 7.80 (2H, s)

【0152】

【参考例3】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-ジメチルアミノメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサ

211

ジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 0.91g(1.89mmol)にトルエン10mlを加え、さらにN,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 0.56ml(純度90%; 3.79mmol)を加え、80°Cで4時間撹拌した。溶媒を留去し得られた無色オイルをシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し(酢酸エチル:クロロホルム=1:10)、得られた結晶をクロロホルム-ヘキサン混合溶媒で再結晶し、0.56g(1.03mmol)の1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-ジメチルアミノメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを無色結晶として得た。

収率 55%

mp. 171~173°C

NMR(CDC1₃, δ) 2.79 (3H, s), 3.08 (3H, s), 5.24 (b.r., 1H), 5.41 (1H, d, d, J=1Hz, 3Hz), 5.47 (1H, d, d, J=1Hz, 3Hz), 7.70-7.74 (2H, m), 8.56 (1H, s)

【0153】

【参考例4】5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-ジイソプロポキシメチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール

5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール 1.00g(2.01mmol)をオルトギ酸トリイソプロピル 5mlに溶解した。反応液にバタールエンシルホン酸-水和物 20mgを加え、90°Cで34時間撹拌した。反応液をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し(n-ヘキサン:アセトン=5:1)、淡黄色結晶を得た。得られた結晶を石油エーテル-アセトンで再結晶し、無色結晶として5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-ジイソプロポキシメチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾールを360mg(0.57mmol)得た。

収率 29% mp. 173~176°C

NMR(CDC1₃+DMSO-d₆, δ) 1.10 (6H, d, J=6Hz), 1.11 (6H, d, J=6Hz), 3.85 (2H, sep, J=6Hz), 5.54 (2H, s), 5.66 (1H, s), 6.58 (2H, br), 7.80 (2H, d, J=0.5Hz)

【0154】

【参考例5】3-(4-アセチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

212

1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 520mg(1.00mmol)をアセトニトリル 10mlに懸濁した。反応液にピリジン 82mg(1.04mmol)を加え、無水酢酸 106mg(1.04mmol)のアセトニトリル 5mlの溶液を室温下に滴下し、室温で18時間撹拌した。反応液に4-ジメチルアミノピリジン 127mg(1.04mmol)を加え、さらに室温で5時間撹拌した。

10 反応液を減圧下濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し(n-ヘキサン:酢酸エチル=5:1)、無色結晶を530mg得た。この結晶を酢酸エチル-n-ヘキサンで再結晶し、無色結晶として3-(4-アセチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを400mg(0.70mmol)得た。

収率 70%

mp. 126~127°C

NMR(CDC1₃, δ) 2.14 (3H, s), 3.70 (3H, s), 5.82 (1H, d, J=3Hz), 6.01 (1H, d, J=3Hz), 7.78 (2H, m), 8.64 (1H, s)

【0155】

【参考例6】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(4-アプロピオニル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

30 1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 550mg(1.02mmol)をアセトニトリル 10mlに懸濁した。反応液にピリジン 0.09ml(1.23mmol)、アプロピオン酸無水物 0.157ml(1.23mmol)、4-ジメチルアミノピリジン (DMAP) 150mg(1.23mmol)を加え、室温で4時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し(n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1)、無色液体を得た。この液体をイソプロピルエーテル-石油エーテルで結晶化し、無色結晶として1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(4-アプロピオニル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを440mg(0.74mmol)得た。

収率 72%

mp. 114~115°C

NMR(CDC1₃, δ) 1.07 (3H, t, J=7Hz), 1.22 (3H, t, J=7Hz), 2.

213

3.7 (2H, m), 4.12 (2H, m), 5.81 (1H, d, J=3Hz), 6.02 (1H, d, J=3Hz), 7.76 (2H, m), 8.61 (1H, s)

【0156】

【参考例7】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(4-メチルカルバモイル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール550mg(1.02mmol)をアセトニトリル10mlに懸濁した。反応液にイソシアン酸メチル0.124ml(2.04mmol)を加え、室温で45時間撹拌した。反応液にトリエチルアミン0.285ml(2.04mmol)、イソシアン酸メチル0.124ml(2.04mmol)を追加し、室温でさらに24時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し(n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1)、淡黄色液体を得た。この液体を酢酸エチル-石油エーテルで結晶化し、無色結晶として1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(4-メチルカルバモイル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを370mg(0.62mmol)得た。

収率 61%

mp, 115~116°C

NMR(CDC1₃, δ) 1.21 (3H, t, J=7Hz), 2.75 (3H, d, J=5Hz), 4.11 (2H, m), 5.83 (1H, d, J=2Hz), 6.13 (1H, d, J=2Hz), 7.22 (1H, m), 7.80 (2H, m), 8.56 (1H, s)

【0157】

【参考例8】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-ジエチルカルバモイル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

炭酸ビストリクロロメチル(BTC) 56.2mg(0.189mmol)をTHF 5mlに溶解し、氷冷した。反応液にピリジン 0.0496ml(0.613mmol)を加え、室温で1時間撹拌した。反応液に1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール300mg(0.557mmol)のTHF 5mlの溶液を氷冷下5分で滴下し、室温で1時間撹拌した。反応後、さらにジエチルアミン 0.115ml(1.11mmol)を加え、室温で6時間撹拌した。析出した結晶を濾去し、母液を減圧下濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し(n-ヘキサン:酢酸エチル=3:1)、無色結晶として1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-ジエチルカルバモイル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを220mg(0.34mmol)得た。

214

収率 62%

mp, 107~108°C

NMR(CDC1₃, δ) 1.14 (6H, t, J=7Hz), 1.19 (3H, t, J=7Hz), 3.30 (4H, q, J=7Hz), 4.08 (2H, m), 5.48 (1H, d, J=1Hz), 5.55 (1H, d, J=1Hz), 7.72 (2H, m), 8.58 (1H, s)

【0158】

【参考例9】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-ジメチルアミノアセチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 500mg(0.93mmol)をアセトニトリル10mlに懸濁した。反応液に塩酸、N-ジメチルグリシン 127mg(0.93mmol)、BOP試薬 410mg(0.93mmol)、トリエチルアミン 0.26ml(1.86mmol)を加え、室温で55時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し(n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1)、無色結晶を270mg得た。この結晶をプロピルエーテル-ヘキサンで再結晶し、無色結晶として1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-ジメチルアミノアセチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを150mg(0.24mmol)得た。

収率 26%

mp, 135°C

NMR(CDC1₃, δ) 1.22 (3H, t, J=7Hz), 2.11 (6H, s), 2.95 (1H, d, J=14Hz), 3.40 (1H, d, J=14Hz), 4.11 (m, 2H), 5.60 (1H, d, J=4Hz), 6.11 (1H, d, J=4Hz), 7.76 (2H, m), 8.72 (1H, s)

【0159】

【参考例10】5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-エチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(N1-エチル-N2-ヒドロキシアミノ)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール1.0g(2.0mmol)をアセトニトリル15mlに溶解し、37%ホルマリン水溶液0.8ml(11mmol)、酢酸3

215

滴を加え、加熱還流を7時間行った。反応後、酢酸エチル60mlを加え、飽和重曹水40mlで3回、飽和食塩水20mlで2回洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去すると、淡黄色アモルファスが得られた。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し (n-ヘキサン:酢酸エチル = 3:1)、500mg (0.98mmol) の5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-エチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを無色アモルファスとして得た。

収率 49%。

NMR (CDCl_3 , δ) 1.14 (3H, t, J=7Hz), 3.4-3.7 (2H, m), 5.18 (2H, br), 5.38 (2H, d, J=7Hz), 7.82 (2H, s)

【0160】

【参考例11】3-(4-アセチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 0.89g (1.7mmol) をアセトニトリル10mlに溶解し、4-ジメチルアミノピリジン0.21g (1.72mmol)、無水酢酸0.16ml (1.7mmol) を加え室温で2.5時間攪拌した。反応後、溶媒を留去し、酢酸エチル70mlを加えた。飽和重曹水20mlで2回、飽和食塩水30mlで2回洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去すると淡黄色アモルファスが得られた。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し (n-ヘキサン:酢酸エチル = 2:1)、得られた無色結晶をクロロホルム-n-ヘキサンで再結晶して160mg (0.27mmol) の3-(4-アセチル- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを無色結晶として得た。

収率 16%。

mp. 116-118 °C

NMR (CDCl_3 , δ) 1.22 (3H, t, J=7Hz), 2.14 (3H, s), 4.20-4.25 (2H, m), 5.83 (1H, d, J=3Hz), 6.01 (1H, d, J=3Hz), 7.76-7.80 (2H, m), 8.60 (1H, s)

【0161】

【参考例12】5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-{4-(N, N-ジエチルカルバモイル)- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル}-4-トリフルオロメチルチオピラゾール

炭酸ビストリクロロメチル (BTC) 318mg (1.07mmol) をTHF

216

6mlに溶解し、氷冷した。反応液にピリジン255mg (3.22mmol)を加え、室温で30分攪拌した。反応液に5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルチオピラゾール 1.00g (2.15mmol) のTHF 6mlの溶液を氷冷下に滴下し、同温度で30分攪拌した。反応後、ジエチルアミン472mg (6.45mmol)を加え、氷冷下に3時間攪拌して室温で3時間攪拌した。100mlの水水中にかけ、100mlの酢酸エチルで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し (n-ヘキサン:酢酸エチル = 1:1)、370mg (0.65mmol) の無色結晶として題記化合物を得た。

収率30%

mp. 81-83 °C

NMR (CDCl_3 , δ) 1.16 (6H, t, J=7Hz), 3.30 (4H, q, J=7Hz), 4.34 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.76 (2H, s)

【0162】

【参考例13】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-{4-(N, N-ジエチルカルバモイル)- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル}-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルチオピラゾール 5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-{4-(N, N-ジエチルカルバモイル)- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル}-4-トリフルオロメチルチオピラゾール 370mg (0.65mmol) をオルトギ酸トリエチル3mlに溶解した。反応液にパラトルエンスルホン酸一水和物50mgを加え、室温で3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し (n-ヘキサン:酢酸エチル = 2:1)、290mg (0.47mmol) の無色結晶として題記化合物を得た。

収率72%

mp. 93-95 °C

NMR (CDCl_3 , δ) 1.26-1.14 (9H, m), 3.30 (4H, q, J=7Hz), 4.13 (2H, q, J=7Hz), 5.55 (2H, s), 7.70 (2H, s), 8.33 (1H, s)

【0163】

【参考例14】5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-{4-(N, N-ジメチルカルバモイル)- Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル}-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 炭酸ビストリクロロメチル (BTC) 615mg (2.07mmol) をTHF 12mlに溶解し、氷冷した。反応液にピリジン492mg (6.22mmol)を加え、室温で30分攪拌した。反応液に5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(Δ^2 -1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

217

ラゾール 2.00g (4.15mmol) の THF 12ml の溶液を氷冷下に滴下し、同温度で30分撹拌した。反応後、5.0%ジメチルアミン水溶液 1.12g (12.4mmol) を加え、氷冷下に1時間撹拌した。100ml の氷水中にかけ、100ml の酢酸エチルで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮すると、2.26g (4.08mmol) の無色結晶として題記化合物を得た。

収率98%

m.p. 207.0-207.5°C

NMR (CDCl₃, δ) 2.93 (6H,s), 5.14 (2H,s), 5.46 (1H, d, J=2Hz), 5.52 (1H,d,J=2Hz), 7.78 (2H,s)

【0164】

【参考例15】5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-(N,N-ジエチルカルバモイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

炭酸ビストリクロロメチル(BTC) 113mg (0.38mmol) を THF 10ml に溶解し、氷冷した。反応液にピリジン 0.0923ml (1.14mmol) を加え、室温で30分撹拌した。反応液に5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-(N,N-ジエチルカルバモイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 500mg (1.04mmol) の THF 5ml の溶液を氷冷下に滴下し、室温で1時間撹拌した。反応後、ジエチルアミン 0.322ml (3.11mmol) を加え、室温で15.5時間撹拌した。析出した結晶をろ過し、母液を減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し (n-ヘキサン:酢酸エチル = 2:1)、無色結晶を得た。これを n-ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒で再結晶し、26.0mg (0.45mmol) の題記化合物を無色結晶として得た。

収率43%

m.p. 98.0-99.0°C

NMR (CDCl₃, δ) 1.13 (6H,t,J=7Hz), 3.30 (4H,q,J=7Hz), 5.13 (2H,s), 5.43 (1H,d,J=1Hz), 5.50 (1H,d,J=1Hz), 7.78 (2H,s)

【0165】

【参考例16】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-(N,N-ジエチルカルバモイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール

炭酸ビストリクロロメチル(BTC) 119mg (0.401mmol) を THF 10ml に溶解し、氷冷した。反応液にピリジン 0.0974ml (1.20mmol) を加え、さらに 1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール 400mg (0.803mmol) の THF 5ml の溶液を氷冷下に滴下し、同温度で2時間撹拌した。反応後、ジエチルアミン

218

0.332ml (3.21mmol) を 5ml の THF に溶解して加え、室温で30分撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し (n-ヘキサン:酢酸エチル = 1:1)、130mg (0.20mmol) の題記化合物を無色結晶として得た。

収率25%

m.p. 105.5-106.5°C

NMR (CDCl₃, δ) 1.17 (6H,t,J=7Hz), 1.23 (3H,t,J=6Hz), 3.27 (4H,q,J=7Hz), 4.16 (2H,q,J=7Hz), 5.64 (2H,s), 7.74 (2H,s), 8.04 (1H,s)

【0166】

【参考例17】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-(N,N-ジメチルカルバモイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

炭酸ビストリクロロメチル(BTC) 91.2mg (0.310mmol) を THF 5ml に溶解し、氷冷した。反応液にピリジン 0.0751ml (0.929mmol) を加え、室温で1時間撹拌した。さらに 1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 500mg (0.929mmol) の THF 5ml の溶液を氷冷下に滴下し、室温で1時間撹拌した。反応後、50%ジメチルアミン水溶液 0.167ml (1.86mmol) を 5ml の THF に溶解して滴下し、室温で3.5時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し (n-ヘキサン:酢酸エチル = 2:1)、210mg (0.34mmol) の題記化合物を無色アモルファスとして得た。

収率37%

NMR (CDCl₃, δ) 1.20 (3H,t,J=7Hz), 2.94 (6H,s), 4.10 (2H,m), 5.51 (1H,d,J=2Hz), 5.58 (1H,d,J=2Hz), 7.72 (2H,m), 8.56 (1H,s)

【0167】

【参考例18】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-(N-エチル-N-メチルカルバモイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

炭酸ビストリクロロメチル(BTC) 138mg (0.47mmol) を THF 3ml に溶解し、氷冷した。反応液にピリジン 111mg (1.40mmol) を加え、氷冷下に30分撹拌した。さらに 1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール 500mg (0.93mmol) の THF 3ml 溶液を氷冷下に滴下し、同温度で30分撹拌した。反応後、エチルメチルアミン 110mg (1.86mmol) を 1ml の THF に溶解して滴下し、室温で21時間撹拌した。100ml の水

2.19

水にあげ、100mlの酢酸エチルで抽出した。無水硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し（*n*-ヘキサン：酢酸エチル=3：1）、100mg(0.16mmol)の題記化合物を無色アモルファスとして得た。

収率17%

m.p. 113-114°C

NMR (CDCl₃, δ) 1.14 (3H, t, J=7Hz), 1.20 (3H, t, J=7Hz), 2.93 (3H, s), 3.31 (2H, q, J=7Hz), 4.30-3.90 (2H, m), 5.50 (1H, s), 5.57 (1H, s), 7.72 (2H, s), 8.58 (1H, s)

【0168】

【参考例19】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-(N,N-ジエチルカルバモイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-イソプロポキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

炭酸ビストリクロロメチル(BTC) 85.3mg(0.287mmol)をTHF 10mlに溶解し、氷冷した。反応液にビリジン0.0769ml(0.951mmol)を滴下し、さらに1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-イソプロポキシメチレンアミノ-3-(4-(N,N-ジエチルカルバモイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール500mg(0.905mmol)のTHF 5mlの溶液を氷冷下に滴下し、室温で2時間撹拌した。反応液を氷冷し、ジエチルアミン0.192ml(1.86mmol)を5mlのTHFに溶解して滴下し、室温で22.5時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し（*n*-ヘキサン：酢酸エチル=2：1）、240mg(0.37mmol)の題記化合物を無色液体として得た。

収率41%

NMR (CDCl₃, δ) 0.82 (3H, t, J=7Hz), 1.14 (6H, t, J=7Hz), 1.58 (2H, m), 3.30 (4H, q, J=7Hz), 3.99 (2H, m), 5.48 (1H, d, J=1Hz), 5.55 (1H, d, J=1Hz), 7.72 (2H, m), 8.61 (1H, s)

【0169】

【参考例20】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(4-(ヒバロイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール500mg(0.929mmol)をアセトニトリル10mlに懸濁した。反応液にトリエチルアミン0.142ml(1.02mmol)、塩化ヒバロイル0.166ml(1.02mmol)、4-ジメチルアミノピリジン5mgを加え、室温で4日間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をシ

2.20

リカゲルカラムクロマトグラフィーに付し（*n*-ヘキサン：酢酸エチル=3：1）、220mg(0.35mmol)の題記化合物を無色結晶として得た。

収率38%

m.p. 133.5-134.0°C

NMR (CDCl₃, δ) 1.21 (3H, t, J=7Hz), 1.28 (9H, s), 4.11 (2H, m), 5.71 (1H, d, J=2Hz), 5.88 (1H, d, J=2Hz), 7.72 (1H, s), 7.73 (1H, s), 8.54 (1H, s)

【0170】

【参考例21】3-(4-(4-ヒブトキシカルボニル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-エトキシメチレンアミノ-3-(Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール538mg(1.00mmol)をアセトニトリル10mlに溶解し、室温で撹拌しながらビリジン0.097ml(1.20mmol)およびDi-*t*-butyldicarbonyl 270mg(1.2mmol)を加えた。更に4-ジメチルアミノピリジン147mg(1.20mmol)を加え、室温で2時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し（*n*-ヘキサン：酢酸エチル=4：1）、485mg(0.76mmol)の題記化合物を無色アモルファスとして得た。

収率76%

NMR (CDCl₃, δ) 1.22 (3H, t, J=7Hz), 1.45 (9H, s), 3.98-4.26 (2H, m), 5.73 (1H, d, J=2Hz), 5.78 (1H, d, J=2Hz), 7.72-7.78 (2H, m), 8.61 (1H, s)

【0171】

【参考例22】1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(4-(N,N-ジエチルカルバモイル)-Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-5-ジメチルアミノメチレンアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール

炭酸ビストリクロロメチル(BTC) 0.14g(0.47mmol)をTHF 5mlに溶解し、氷冷後、ビリジン0.13ml(1.62mmol)を加えた。室温で35分間撹拌し、ここにTHF 5mlに溶解した1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-ジメチルアミノメチレンアミノ-3-(Δ²-1,2,4-オキサジアゾリン-3-イル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール0.45g(0.84mmol)を氷冷下に滴下した。滴下後室温で1時間撹拌し、ジエチルアミン 0.18ml (1.74mmol)を氷冷下で投入した。その後、氷冷下で30分、室温で12時間撹拌後、ジエチルアミン 0.09ml (0.86mmol)を追加し、さらに室温で1.5時間撹拌した。水20ml、飽和食塩水20mlを加え酢酸エチル40mlで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水20ml×2で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し

221

た。溶媒を留去し、得られた反応混合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:1)により精製した。シリカゲルカラム後得られた結晶を酢酸エチル:ヘキサン=1:5で洗浄し、酢酸エチル-ヘキサン混合溶媒20mlより再結晶し、0.30g (0.47mmol)の題記化合物を無色結晶として得た。

収率57%

m.p. 156~158°C

¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.14 (6H, t, J=7.2Hz), 2.78 (3H, s), 3.07 (3H, s), 3.30 (4H, q, J=7Hz), 5.47 (1H, d, J=1Hz), 5.54 (1H, d, J=1Hz), 7.66-7.71 (2H, m), 8.65 (s, 1H) 【0172】上記〔表37〕～〔表70〕中の油状物およびアモルファスの¹H-NMRスペクトルを以下に示す。

1) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.09 (6H, d, J=7Hz), 1.25 (3H, t, J=7Hz), 2.61 (1H, qu, J=7Hz), 4.16 (2H, q, J=7Hz), 5.93 (2H, s), 7.76 (2H, s), 8.37 (1H, s)

2) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.10 (6H, d, J=8Hz), 1.22 (3H, t, J=7Hz), 2.80 (1H, m), 4.12 (2H, m), 5.81 (1H, d, J=3Hz), 6.00 (1H, d, J=3Hz), 7.76 (2H, s), 8.60 (1H, s)

3) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 0.83 (3H, t, J=8Hz), 1.08 (3H, d, J=7Hz), 1.25 (3H, t, J=7Hz), 1.30-1.80 (1H, m), 2.44 (2H, q, J=7Hz), 4.16 (2H, q, J=7Hz), 5.87 (1H, d, J=2Hz), 6.00 (1H, d, J=2Hz), 7.75 (2H, s), 8.37 (1H, s)

4) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.23 (3H, t, J=7Hz), 1.31 (9H, s), 4.44 (2H, q, J=7Hz), 4.14 (2H, q, J=7Hz), 5.84 (2H, s), 7.71 (2H, s), 8.34 (1H, s)

5) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.20 (3H, t, J=7Hz), 2.94 (6H, s), 4.10 (2H, m), 5.51 (1H, d, J=2Hz), 5.58 (1H, d, J=2Hz), 7.72 (2H, m), 8.56 (1H, s)

6) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.10 (3H, d, J=6Hz), 1.23 (3H, d, J=6Hz), 2.95 (6H, s), 4.84 (1H, qu, J=6Hz), 5.51 (1H, d, J=2Hz), 5.59 (1H, d, J=2Hz), 7.73 (2H, s), 8.56 (1H, s)

7) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.19 (6H, d, J=6Hz), 2.92 (6H, s), 4.94 (1H, qu, J=6Hz), 5.67 (2H, s), 7.75 (2H, s), 8.00 (1H, s)

8) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 0.84 (3H, t, J=7Hz), 1.20-1.40 (2H, m), 1.5-1.6 (2H, m), 2.95 (6H, s), 4.10 (2H, dt, J=1Hz, 6.6Hz), 5.58 (2H, s), 7.71-7.72 (2H, m), 8.35 (1H, s)

9) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 0.82 (3H, t, J=7Hz), 1.14 (6H, t, J=7Hz), 1.58 (2H, m), 3.30 (4H, q, J=7Hz), 3.99 (2H, m), 5.48 (1H, d, J=1Hz), 5.55 (1H, d, J=1Hz), 7.72 (2H, m), 8.61 (1H, s)

10) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 0.84 (3H, t, J=7Hz), 1.16 (6H, t, J=7Hz), 1.61 (2H, m), 3.27 (4H, q, J=7Hz), 4.07 (2H, t, J=7Hz), 5.63 (2H, s), 7.74 (2H, s), 8.06 (1H, s)

11) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.17 (6H, t, J=7Hz), 1.90 (6H, d, J=6Hz), 3.32 (4H, q, J=7Hz), 4.93 (1H, qu, J=6Hz), 5.55 (2H, s), 7.70 (2H, s), 8.29 (1H, s)

12) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.12-1.23 (12H, m), 3.28 (4H, q, J=7

222

Hz), 4.83-5.05 (1H, m), 5.63 (2H, s), 7.74 (2H, m), 7.99 (1H, s)

13) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 0.84 (3H, t, J=7Hz), 1.17 (6H, t, J=7Hz), 1.25-1.40 (2H, m), 1.49-1.63 (2H, m), 3.32 (4H, q, J=7Hz), 4.10 (2H, d, J=6Hz), 5.55 (2H, s), 7.71 (2H, s), 8.36 (1H, s)

14) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 0.84 (3H, t, J=7Hz), 1.17 (6H, t, J=7Hz), 1.22-1.36 (2H, m), 1.48-1.59 (2H, m), 3.28 (4H, q, J=7Hz), 4.13 (2H, t, J=6Hz), 5.64 (2H, s), 7.74 (2H, s), 8.05 (1H, s)

15) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.17 (3H, t, J=7Hz), 1.26 (3H, t, J=7Hz), 2.90 (3H, s), 3.30 (2H, q, J=7Hz), 4.17 (2H, d, J=7Hz), 5.65 (2H, s), 7.75 (2H, s), 8.05 (1H, s)

16) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.26-1.14 (9H, m), 2.93 (3H, s), 3.33 (2H, q, J=7Hz), 4.94 (1H, qu, J=6Hz), 5.57 (2H, s), 7.71 (2H, s), 8.29 (1H, s)

17) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.17 (3H, t, J=7Hz), 1.19 (6H, d, J=6Hz), 2.90 (3H, s), 3.29 (2H, q, J=7Hz), 4.94 (1H, qu, J=6Hz), 5.66 (2H, s), 7.75 (2H, s), 8.00 (1H, s)

18) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 0.84 (3H, t, J=7Hz), 1.33-1.14 (5H, m), 1.57 (2H, qu, J=6Hz), 2.93 (3H, s), 3.33 (4H, q, J=7Hz), 4.10 (2H, t, J=7Hz), 5.57 (2H, s), 7.71 (2H, s), 8.35 (1H, s)

19) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 0.83 (3H, t, J=7Hz), 1.17 (3H, t, J=7Hz), 1.25 (2H, m), 1.55 (2H, m), 2.89 (3H, s), 3.29 (2H, t, J=7Hz), 4.13 (2H, t, J=7Hz), 5.65 (2H, s), 7.74 (2H, m), 8.05 (1H, s)

20) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.14 (3H, t, J=7Hz), 3.4-3.7 (2H, m), 5.18 (2H, br), 5.38 (2H, d, J=7Hz), 7.82 (2H, s)

21) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.14 (6H, d, J=7Hz), 1.23 (3H, t, J=7Hz), 2.86 (3H, s), 4.17 (2H, q, J=7Hz), 4.42 (1H, qu, J=7Hz), 5.88 (2H, s), 7.74 (2H, s), 8.03 (1H, s)

22) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.23 (3H, t, J=7Hz), 1.36 (9H, s), 2.93 (3H, s), 4.07-4.19 (2H, m), 5.56 (2H, s), 7.71 (2H, s), 8.35 (1H, s)

23) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.20 (3H, t, J=7Hz), 1.35 (9H, s), 2.91 (3H, s), 4.00-4.19 (2H, m), 5.46 (1H, d, J=2Hz), 5.57 (1H, d, J=2Hz), 7.71-7.74 (2H, m), 8.60 (1H, s)

24) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.23 (3H, t, J=7Hz), 1.33 (9H, s), 4.17 (2H, q, J=7Hz), 5.63 (2H, s), 7.75 (2H, s), 8.06 (1H, s)

25) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.12-1.26 (12H, m), 3.22 (2H, q, J=7Hz), 4.00-4.20 (2H, m), 5.48 (1H, d, J=1Hz), 5.54 (1H, d, J=1Hz), 7.72-7.74 (2H, m), 8.59 (1H, s)

26) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.20 (3H, t, J=7Hz), 2.91 (3H, s), 4.03-3.73 (4H, m), 5.16 (1H, q, J=2Hz), 5.23 (1H, d, J=2Hz), 5.48 (2H, d, J=2Hz), 5.58 (1H, d, J=2Hz), 5.66-5.86 (1H, m), 7.74 (2H, s), 8.57 (1H, s)

27) ¹H NMR (CDCl₃, δ) 1.04 (3H, t, J=7Hz), 1.14 (3H, t, J=7Hz), 1.20 (3H, t, J=7Hz), 2.85 (2H, m), 3.52 (2H, m),

2.2.3

4.10 (2H,m), 5.66 (1H,d,J=2Hz), 5.70 (1H,d,J=2Hz), 7.71 (2H,m), 8.59 (1H,s)
 28) NMR(CDCl₃, δ) 1.21 (3H,t,J=7Hz), 3.99-4.26 (2H,m), 5.75 (1H,d,J=2Hz), 5.99 (1H,d,J=2Hz), 7.69 (1H,brs), 7.79 (2H,m), 8.51 (1H,s), 9.77 (1H,s)
 29) NMR(CDCl₃, δ) 1.21 (3H,t,J=7Hz), 3.68 (3H,s), 3.99-4.26 (2H,m), 5.80 (1H,d,J=2Hz), 6.06 (1H,d,J=2Hz), 7.81 (2H,m), 8.54 (1H,s), 9.90 (1H,s)
 30) NMR(CDCl₃, δ) 1.21 (3H,t,J=7Hz), 3.12 (3H,s), 3.98-4.25 (2H,m), 5.57 (1H,d,J=3Hz), 5.71 (1H,d,J=3 Hz), 7.70-7.82 (2H,m), 8.06 (1H,brs), 8.45 (1H,s)
 31) NMR(CDCl₃, δ) 1.20 (3H,t,J=7Hz), 1.00-1.50 (4H,m), 1.60-1.80 (6H,m), 2.83 (3H,s), 3.70-3.90 (1H,m), 4.00-4.20 (2H,m), 5.48 (1H,d,J=2Hz), 5.55 (1H,d,J=2Hz), 7.71-7.74 (2H,m), 8.58 (1H,s)
 32) NMR(CDCl₃, δ) 1.20 (3H,t,J=7Hz), 1.60 (6H,br), 3.30-3.40 (4H,m), 4.00-4.20 (2H,m), 5.49 (1H,d,J=2 Hz), 5.56 (1H,d,J=2Hz), 7.72-7.75 (2H,m), 8.59 (1H,s)
 33) NMR(CDCl₃, δ) 1.20 (3H,t,J=7Hz), 2.25 (3H,s), 2.38 (4H,t,J=5Hz), 3.46 (4H,t,J=5Hz), 4.10 (2H,m), 5.59 (1H,d,J=2Hz), 5.76 (1H,d,J=2Hz), 7.73 (2H,m), 8.57 (1H,s)
 34) NMR(CDCl₃, δ) 1.21 (3H,t,J=7Hz), 3.42-3.47 (4H,m), 3.67 (4H,t,J=5Hz), 4.00-4.20 (2H,m), 5.49 (1H,d,J=2Hz), 5.57 (1H,d,J=2Hz), 7.72-7.77 (2H,m), 8.57 (1H,s)
 35) NMR(CDCl₃, δ) 0.81-1.67 (18H,m), 2.20-2.50 (2H,m), 3.98-4.27 (2H,m), 5.82 (1H,d,J=3Hz), 6.00 (1H,d,J=3Hz), 7.73-7.81 (2H,m), 8.61 (1H,s)
 36) NMR(CDCl₃, δ) 0.81-1.67 (20H,m), 2.20-2.50 (2H,m), 3.98-4.27 (2H,m), 5.82 (1H,d,J=3Hz), 6.00 (1H,d,J=3Hz), 7.73-7.81 (2H,m), 8.61 (1H,s)
 37) NMR(CDCl₃, δ) 1.22 (3H,t,J=7Hz), 1.45-1.74 (4H,m), 2.55 (1H,m), 4.11 (2H,m), 5.81 (1H,d,J=3Hz), 6.04 (1H,d,J=3Hz), 7.76 (2H,m), 8.62 (1H,s)
 38) NMR(CDCl₃, δ) 1.00 (9H,s), 1.22 (3H,t,J=7Hz), 2.25 (1H,d,J=15.3Hz), 2.31 (1H,d,J=15.3Hz), 3.99-4.27 (2H,m), 5.81 (1H,d,J=3Hz), 5.98 (1H,d,J=3Hz), 7.73-7.81 (2H,m), 8.62 (1H,s)

* 40

2.2.4

* 39) NMR(CDCl₃, δ) 1.21 (3H,t,J=7Hz), 3.98-4.25 (2H,m), 5.98 (1H,d,J=3Hz), 6.05 (1H,d,J=3Hz), 6.47 (1H,d,J=15Hz), 7.27-7.45 (5H,m), 7.63-7.71 (2H,m), 7.76 (1H,d,J=15Hz), 8.58 (1H,s)
 40) NMR(CDCl₃, δ) 1.22 (3H,t,J=7Hz), 3.75 (3H,s), 3.98-4.26 (2H,m), 5.73 (1H,d,J=2Hz), 5.86 (1H,d,J=2 Hz), 7.72-7.78 (2H,m), 8.60 (1H,s)
 41) NMR(CDCl₃, δ) 1.22 (3H,t,J=7Hz), 1.24 (3H,t,J=7 Hz), 4.11 (2H,m), 5.73 (1H,d,J=2Hz), 4.22 (2H,q,J=7 Hz), 5.76 (1H,d,J=2Hz), 5.83 (1H,d,J=2Hz), 7.75 (2H,m), 8.59 (1H,s)
 42) NMR(CDCl₃, δ) 1.17-1.29 (9H,m), 3.98-4.27 (2H,m), 5.00 (1H,7重線,J=6Hz), 5.77 (1H,d,J=2Hz), 5.80 (1H,d,J=2Hz), 7.72-7.79 (2H,m), 8.59 (1H,s)
 43) NMR(CDCl₃, δ) 1.22 (3H,t,J=7Hz), 1.45 (9H,s), 3.98-4.26 (2H,m), 5.73 (1H,d,J=2Hz), 5.78 (1H,d,J=2 Hz), 7.72-7.78 (2H,m), 8.61 (1H,s)
 44) NMR(CDCl₃, δ) 1.24 (3H,t,J=7Hz), 1.44 (9H,s), 4.17 (2H,q,J=7Hz), 5.78 (2H,s), 7.76 (2H,m), 8.13 (1H,s)

20

【0173】次に、試験例を示す。

【0174】試験例1

ワタアブラムシに対する防除効果

ベストガード粒剤 (1%粒剤) (武田薬品工業(株))
 (1%の1-N-(6-クロロロ-3-ピリジルメチル)-N-エチルアミノ)-1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン含有粒剤)を混和した「ニヒ良菜培土 (日本肥料(株))70gを直径6cmのポリポットに充填し、キュウリ(品種:四葉)を播種した。15~25℃のガラス温室内で、灌水、施肥を行って育苗し、播種3週間後の3葉期苗を1/5000アールのワグナーポットに定植した。対照として、上記と同様の方法で育苗した3葉期苗を1/5000アールのワグナーポットに定植時に植穴処理土壌混和をした区をそれぞれ3つ設けた。上記定植6週間後から2週間間隔で、各株から中位葉一枚を選んでワタアブラムシ無翅成虫10頭を放飼し、その5日後に上記放飼虫対策における生存虫数を調査した。上記試験結果を表71に示す。

【0175】

【表71】

薬剤施用方法	処理量	ワタアブラムシ密度指数 ¹³⁾				葉害
		8週間後 ²⁾	8週間後	10週間後	12週間後	
育苗培土混和	1 g/株 ¹³⁾	0	3	23	60	—
	2 g/株 ¹³⁾	0	1	8	43	—
定植時植穴処	1 g/株	0	5	12	47	—
理土壌混和	2 g/株	0	0	0	37	—
無処理	—	100(215)	100(196)	100(191)	100(234)	—

225

- 1) 無処理区の密度を100とした場合の密度指数を示し、()内は1葉当たりの生存虫数を示す。
- 2) 苗定植後の期間でアブラムシ放飼時期を示す。
- 3) 育苗培土1リットル当たり14.3g(有効成分量で0.143g)を混和した。
- 4) 育苗培土1リットル当たり28.6g(有効成分量で0.286g)を混和した。

【0176】試驗例2

アブラムシ類およびアザミウマ類に対する防除効果

ベストガード粒剤（１％粒剤）（武田薬品工業（株）） １

あるいはアドマイヤー1粒剤（1%の1-（6-クロロホ

226

キー3-ヒリジメチル)-N-ニトロイミダゾリジン
-2-イリジン系)含有殺剤) (日本バエリアルグ
ゲーム (株)) を1リットル当たり1gあるいは2g混
した育苗用培土(カキ育苗培土)を用いて、以下の作
物を育苗した。果菜類は、上記育苗培土を充填した20
0gセルトレーに播種し、15-30日後に、上記育苗培
土を用いて直径9cmのポリポットに仮植し、更に約30日
間育苗した。葉菜類は、上記育苗培土を充填した128
gセルトレーに播種し、約20-25日間育苗した。

【0177】

【表7 2】

作物名	品種名
トマト	桃太郎, ハス桃太郎, 桃太郎R8, 桃太郎T93, 桃太郎ネーグ, メリロード, キンロード, ミニキロー, ココ, 影武者, アソカ-T, ドクターM, 新メイロ, ヘルム-M, アキレスM
ナス	千両2号, 筑紫, くぐく, くぐれ, 早生大丸, 黒黒, 飛天長, 美男竹, 大茄子, トルハム, 耐病VF, 赤竹, 台太郎, ミート
キュウリ	夏時雨, くらげ, シェアーズ, シアーズ5, シアーズ7, アソコ-R8, アソコ-R10, アソコ-R11, ニュース-R ⁺ -雲竜, ひかり ⁺ ター, エキサイト-輝, ストロガ-輝, くらげ, シェル-R ⁺
スイカ	綺王, 紅小王, 瑞祥, トンX
メロン	アリンズメロン, シェースト
甜*薯	さび
ピーマン	京波, 京どり, 京軟皮, コーキング ⁺ ハ, マンター-R ⁺ ハ
青とう	しとう
イチゴ	アリー5, 東京五角くら
ジャ	青じ
トウモロコシ	シスコ, 極早生シコ
ミニトマト	晚抽レッドファイヤー, レッドファイヤー
ハクサイ	優良, 大福, 新理想, CR新黄, . 金輝, 千勝, 空海70
ブロッコリー	エンゼルハート, ハウス, クリーンハート, ターラズフェイス, クリーンビューティー
オクラ	スーパークウ, スノーキング, スノーニュータウ

【0178】その結果、二薬剤共に薬害もなく、何れの作物においても無処理区と比較してアブラムシ類およびアザミウマ類に対して明らかな防除効果が認められた。

【0179】試驗例3

モモアカアブラムシに対する防除効果

ベストガード粒剤を１リットル当たり２．５ｇあるいは
５ｇ、あるいはＴＩ－４３５粒剤（武田薬品工業
（株））（１－（２－クロロ－５－チアゾリルメチル）
－３－メチル－２－ニトログアニジン）を０．５％含有す
る粒剤）を１リットル当たり１．２５ｇあるいは２．５

※ 各混した育苗用培土「ニッピ良菜培土（日本肥料（株）」を、1.28穴穴トレーに充填し、ナス（品種：千両）を播種した。15〜25℃のガラス室内で、灌水、施肥を行って育苗し、播種2日後に、直径9cmのポリポットに仮植した。播種15日後から一週間隔で、そのモリアブラムシ無阻達成虫10頭/株を放飼し、その5日後に生存虫数を調査した。上記試験結果を表7.3に示す。

【表7 3】

227		228					
薬剤	処理薬量	モモアカアブラムシ密度指数 ¹⁾					被害
		15日後 ²⁾	22日後	29日後	36日後	43日後	
ベストガード粒剤	2.5g/リットル	1	0	0	5	13	—
	5.0g/リットル	0	0	0	0	0	—
T I-435粒剤	1.25g/リットル	1	0	0	0	0	—
	2.5g/リットル	0	0	0	0	0	—
無処理	—	100	100	100	100	100	—

1) 無処理区の密度を100とした場合の密度指数を示す。

2) 播種後の期間でアブラムシ放飼時期を示す。

【0180】

【発明の効果】本発明は、播種または仮植前に農薬活性成分を混和した育苗用培土を充填した育苗用容器で育苗することと特徴とする、イネを除く被子植物に対する害虫の防除方法であり、育苗期ばかりでなく、本圃に移植後も殺虫効果を発現させ、一度だけの処理で長期間の高い防除効果を発現させることを特徴とする害虫防除方法*

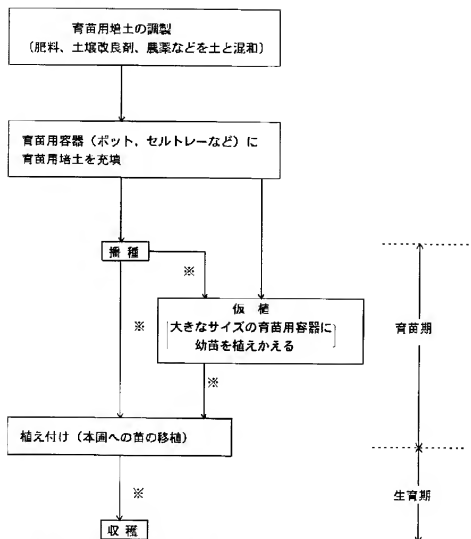
*であり、従来の方法と比較して薬剤処理回数を大幅に減らすことができる。しかも、農閑期の作業として、育苗用培土調製時の通常作業として肥料などの混和時に同時に処理できる。その結果、大幅な労力低減を可能にする。

【0181】

【図面の簡単な説明】

【図1】作物の栽培手順のフロー・チャートを示す。

【図1】



フロントページの続き

(51)Int.Cl. ⁶	識別記号	F I	
A 0 1 N 43/80	1 0 1	A 0 1 N 43/80	1 0 1
43/84	1 0 1	43/84	1 0 1
43/90		43/90	
47/18		47/18	
51/00		51/00	
55/00		55/00	C
C 0 7 D 487/04	1 5 0	C 0 7 D 487/04	1 5 0
// C 0 7 D 231/38		231/38	B

(1 1 7)

特開平11-171702

403/04 2 3 1
403/06 2 0 7
2 2 5
2 3 1
403/12 2 0 9
405/04 2 3 1
409/06 2 3 1
413/04 2 3 1
413/06 2 0 3
2 0 7
2 3 1
498/04
521/00

403/04 2 3 1
403/06 2 0 7
2 2 5
2 3 1
403/12 2 0 9
405/04 2 3 1
409/06 2 3 1
413/04 2 3 1
413/06 2 0 3
2 0 7
2 3 1
521/00
498/04 1 1 2 Q